

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2001-335576

(P2001-335576A)

(43) 公開日 平成13年12月4日 (2001.12.4)

(51) Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テ-マコード [*] (参考)
C 0 7 D 471/04	1 0 2	C 0 7 D 471/04	1 0 2 4 C 0 6 5
A 6 1 K 31/437		A 6 1 K 31/437	4 C 0 8 4
45/00		45/00	4 C 0 8 6
A 6 1 P 13/00		A 6 1 P 13/00	
13/10		13/10	

審査請求 未請求 請求項の数9 OL (全 50 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2001-85190 (P2001-85190)
(22) 出願日 平成13年3月23日 (2001.3.23)
(31) 優先権主張番号 特願2000-88523 (P2000-88523)
(32) 優先日 平成12年3月24日 (2000.3.24)
(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(71) 出願人 000002934
武田薬品工業株式会社
大阪府大阪市中央区道修町四丁目1番1号
(72) 発明者 石原 雄二
兵庫県伊丹市山田3丁目3番8号
(72) 発明者 土居 孝行
大阪府和泉市鶴山台1丁目10番地25号
(72) 発明者 石地 雄二
大阪府茨木市大正町1丁目1-210
(74) 代理人 100062144
弁理士 青山 葆 (外1名)

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 三環式縮合複素環誘導体の結晶

(57) 【要約】

【課題】 優れたアセチルコリンエステラーゼ阻害作用、膀胱排出力改善作用を有する安定な三環式縮合複素環誘導体の結晶の提供。

【解決手段】 8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-i j]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶およびそれを含有する医薬組成物。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-i j]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶。

【請求項2】 融点が110℃以上である請求項1記載の結晶。

【請求項3】 融点が約113℃〜約118℃である請求項1記載の結晶。

【請求項4】 請求項1記載の結晶を含有してなる医薬組成物。

【請求項5】 アセチルコリンエステラーゼ阻害剤である請求項4記載の医薬組成物。

【請求項6】 膀胱排出力改善剤である請求項4記載の医薬組成物。

【請求項7】 排尿障害治療剤である請求項4記載の医薬組成物。

【請求項8】 排尿困難治療剤である請求項4記載の医薬組成物。

【請求項9】 8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-i j]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶と α 遮断剤とを組み合わせることを特徴とする膀胱排出力改善剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用、膀胱排出力改善作用を有する三環式縮合複素環誘導体の結晶、その結晶を含有してなる医薬組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-i j]キノリン-4-オンまたはその塩の無晶形の物質は、特開平7-206854号に記載されている。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】医薬産業上、吸収性が良く、安定なアセチルコリンエステラーゼ阻害剤、膀胱排出力改善剤および排尿障害・排尿困難治療剤の結晶が望まれている。

【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、鋭意検討した結果、高純度、高品質であり、吸湿性が低く、通常条件下で長期間保存しても変質せず、安定性に極めて優れた、8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-

1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-i j]キノリン-4-オンの結晶を得ることに成功し、本発明を完成した。すなわち、本発明は、(1)8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-i j]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶、(2)融点が110℃以上である上記(1)記載の結晶、(3)融点が約113℃〜約118℃である上記(1)記載の結晶、(4)上記(1)記載の結晶を含有してなる医薬組成物、(5)アセチルコリンエステラーゼ阻害剤である上記(4)記載の医薬組成物、(6)膀胱排出力改善剤である上記(4)記載の医薬組成物、(7)排尿障害治療剤である上記(4)記載の医薬組成物、(8)排尿困難治療剤である上記(4)記載の医薬組成物、(9)8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-i j]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶と α 遮断剤とを組み合わせることを特徴とする膀胱排出力改善剤に関する。

【0005】(1)製造法

本発明の8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-i j]キノリン-4-オンの結晶(以下、「本発明の結晶」と略記することもある)は、8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-i j]キノリン-4-オンを自体公知の方法で結晶化することによって製造することができる。そのような結晶化の方法としては、例えば、溶液からの結晶化、蒸気からの結晶化、溶融体からの結晶化が挙げられる。該「溶液からの結晶化」の方法としては、例えば濃縮法、除冷法、反応法(拡散法、電解法)、水熱育成法、融剤法などが挙げられる。用いられる溶媒としては、例えば、芳香族炭化水素類(例、ベンゼン、トルエン、キシレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例、ジクロロメタン、クロロホルム等)、飽和炭化水素類(例、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等)、エーテル類(例、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等)、ニトリル類(例、アセトニトリル等)、ケトン類(例、アセトン等)、スルホキシド類(例、ジメチルスルホキシド等)、酸アミド類(例、N,N-ジメチルホルムアミド等)、エステル類(例、酢酸エチル等)、アルコール類(例、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等)、水などが用いられる。これらの溶媒は単独あるいは二種以上を適当な割合(例、1:1ないし1:100)で混合して用いられる。該「蒸気からの結晶

化」の方法としては、例えば気化法（封管法、気流法）、気相反応法、化学輸送法などが挙げられる。該「溶融体からの結晶化」の方法としては、例えばノルマルフリージング法（引上げ法、温度傾斜法、ブリッジマン法）、帯溶融法（ゾーンレベリング法、フロートゾーン法）、特殊成長法（VLS法、液相エピタキシー法）などが挙げられる。得られた結晶の解析方法としては、X線回折による結晶解析の方法が一般的である。さらに、結晶の方位を決定する方法としては、機械的な方法または光学的な方法なども挙げられる。

8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ヒペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンまたはその塩の無晶形のもは、公知物質であり、例えば特開平7-206854号の明細書に記載した方法あるいはこれに準ずる方法により製造することができる。これを上記の結晶化法に適用することで本発明の結晶が得られる。

【0006】(2) 塩

8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ヒペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンの塩としては、薬理的に許容される塩が好ましく、例えば無機酸との塩、有機酸との塩などが挙げられる。無機酸との塩の好適な例としては、例えば塩酸、臭化水素酸、硝酸、硫酸、リン酸などとの塩が挙げられる。有機酸との塩の好適な例としては、例えば乳酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、シュウ酸、酒石酸、マレイン酸、クエン酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸などとの塩が挙げられる。

【0007】(3) 結晶の性質

本発明の結晶としては、例えば110℃以上の融点を有し、粉末X線結晶回折により、面間隔(d値)約17.4、約8.68、約5.27、約4.97、約4.76、約4.31、約3.85オングストロームに特徴的ピークを有する回折パターンを示すものなどが挙げられる。好ましくは、例えば約113℃〜約118℃の融点を有し、粉末X線結晶回折により、面間隔(d値)約17.4、約8.68、約5.27、約4.97、約4.76、約4.31、約3.85オングストロームに特徴的ピークを有する回折パターンを示すものである。本発明の結晶は、高純度（純度99.9%）、高品質であり、吸湿性が低く、通常条件下で長期間保存しても変質せず、安定性に極めて優れている。

【0008】(4) 処方

本発明の結晶は、毒性が低く、そのまま、または薬理的に許容し得る担体などと混合して医薬組成物とすることにより、哺乳動物（例、ヒト、マウス、ラット、ウサギ、イヌ、ネコ、ウシ、ウマ、ブタ、サル等）に対して、後述する各種疾患の予防・治療剤として用いること

ができる。ここにおいて、薬理的に許容される担体としては、製剤素材として慣用の各種有機あるいは無機担体物質が用いられ、固形製剤における賦形剤、滑沢剤、結合剤、崩壊剤；液状製剤における溶剤、溶解補助剤、懸濁化剤、等張化剤、緩衝剤、無痛化剤などとして配合される。また必要に応じて、防腐剤、抗酸化剤、着色剤、甘味剤などの製剤添加物を用いることもできる。賦形剤の好適な例としては、例えば乳糖、白糖、D-マンニトール、D-ソルビトール、デンプン、 α 化デンプン、デキストリン、結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、アラビアゴム、デキストリン、プルラン、軽質無水ケイ酸、合成ケイ酸アルミニウム、メタケイ酸アルミン酸マグネシウムなどが挙げられる。滑沢剤の好適な例としては、例えばステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム、タルク、コロイドシリカなどが挙げられる。結合剤の好適な例としては、例えば α 化デンプン、ショ糖、ゼラチン、アラビアゴム、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、結晶セルロース、白糖、D-マンニトール、トレハロース、デキストリン、プルラン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドンなどが挙げられる。崩壊剤の好適な例としては、例えば乳糖、白糖、デンプン、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースカルシウム、クロスカルメロースナトリウム、カルボキシメチルスターチナトリウム、軽質無水ケイ酸、低置換度ヒドロキシプロピルセルロースなどが挙げられる。

【0009】溶剤の好適な例としては、例えば注射用水、生理的食塩水、リンゲル液、アルコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ゴマ油、トウモロコシ油、オリーブ油、綿実油などが挙げられる。溶解補助剤の好適な例としては、例えばポリエチレングリコール、プロピレングリコール、D-マンニトール、トレハロース、安息香酸ベンジル、エタノール、トリスアミノメタン、コレステロール、トリエタノールアミン、炭酸ナトリウム、クエン酸ナトリウム、サリチル酸ナトリウム、酢酸ナトリウムなどが挙げられる。懸濁化剤の好適な例としては、例えばステアリルトリエタノールアミン、ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリルアミノプロピオン酸、レシチン、塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウム、モノステアリン酸グリセリンなどの界面活性剤；例えばポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、カルボキシメチルセルロースナトリウム、メチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロースなどの親水性高分子；ポリソルベート類、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油などが挙げられる。等張化剤の好適な例としては、例えば塩化ナトリウム、グリセリン、D-マン

ニトール、D-ソルビトール、ブドウ糖などが挙げられる。緩衝剤の好適な例としては、例えばリン酸塩、酢酸塩、炭酸塩、クエン酸塩などの緩衝液などが挙げられる。無痛化剤の好適な例としては、例えばベンジルアルコールなどが挙げられる。

【0010】防腐剤の好適な例としては、例えばパラオキシ安息香酸エステル類、クロロブタノール、ベンジルアルコール、フェネチルアルコール、デヒドロ酢酸、ソルビン酸などが挙げられる。抗酸化剤の好適な例としては、例えば亜硫酸塩、アスコルビン酸塩などが挙げられる。着色剤の好適な例としては、例えば水溶性食用タール色素（例、食用赤色2号および3号、食用黄色4号および5号、食用青色1号および2号などの食用色素、水不溶性レーキ色素（例、上記水溶性食用タール色素のアルミニウム塩など）、天然色素（例、 β -カロチン、クロロフィル、ベンガラなど）などが挙げられる。甘味剤の好適な例としては、例えばサッカリンナトリウム、グリチルリチン二カリウム、アスパルテーム、ステビアなどが挙げられる。

【0011】(5) 投与形態

医薬組成物の剤形としては、例えば錠剤、カプセル剤（ソフトカプセル、マイクロカプセルを含む）、顆粒剤、散剤、シロップ剤、乳剤、懸濁剤などの経口剤；および注射剤（例、皮下注射剤、静脈内注射剤、筋肉内注射剤、腹腔内注射剤など）、外用剤（例、経鼻投与製剤、経皮製剤、軟膏剤など）、坐剤（例、直腸坐剤、膣坐剤など）、ペレット、点滴剤等の非経口剤が挙げられ、これらはそれぞれ経口的あるいは非経口的に安全に投与できる。医薬組成物は、製剤技術分野において慣用の方法、例えば日本薬局方に記載の方法等により製造することができる。以下に、製剤の具体的な製造法について詳述する。

【0012】例えば、経口剤は、有効成分に、例えば賦形剤（例、乳糖、白糖、デンプン、D-マンニトールなど）、崩壊剤（例、カルボキシメチルセルロースカルシウムなど）、結合剤（例、 α -化デンプン、アラビアゴム、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルピロリドンなど）または滑沢剤（例、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ポリエチレングリコール6000など）などを添加して圧縮成形し、次いで必要により、味のマスクング、腸溶性あるいは持続性を目的として、コーティング基剤を用いて自体公知の方法でコーティングすることにより製造される。該コーティング基剤としては、例えば糖衣基剤、水溶性フィルムコーティング基剤、腸溶性フィルムコーティング基剤、徐放性フィルムコーティング基剤などが挙げられる。糖衣基剤としては、白糖が用いられ、さらに、タルク、沈降炭酸カルシウム、ゼラチン、アラビアゴム、プルラン、カルナバロウなどから選ばれる1種または2種以上を併用してもよい。水溶性フィルムコーティング

基剤としては、例えばヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、メチルヒドロキシエチルセルロースなどのセルロース系高分子；ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート、アミノアルキルメタアクリレートコポリマーE〔オイドラギットE（商品名）、ロームファルマ社〕、ポリビニルピロリドンなどの合成高分子；プルランなどの多糖類などが挙げられる。腸溶性フィルムコーティング基剤としては、例えばヒドロキシプロピルメチルセルロース フタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロース アセテートサクシネート、カルボキシメチルエチルセルロース、酢酸フタル酸セルロースなどのセルロース系高分子；メタアクリル酸コポリマーL〔オイドラギットL（商品名）、ロームファルマ社〕、メタアクリル酸コポリマーLD〔オイドラギットLD-30D55（商品名）、ロームファルマ社〕、メタアクリル酸コポリマーS〔オイドラギットS（商品名）、ロームファルマ社〕などのアクリル酸系高分子；セラックなどの天然物などが挙げられる。徐放性フィルムコーティング基剤としては、例えばエチルセルロースなどのセルロース系高分子；アミノアルキルメタアクリレートコポリマーRS〔オイドラギットRS（商品名）、ロームファルマ社〕、アクリル酸エチル・メタアクリル酸メチル共重合体懸濁液〔オイドラギットNE（商品名）、ロームファルマ社〕などのアクリル酸系高分子などが挙げられる。上記したコーティング基剤は、その2種以上を適宜の割合で混合して用いてもよい。また、コーティングの際に、例えば酸化チタン、三酸化鉄等のような遮光剤を用いてもよい。注射剤は、有効成分を分散剤（例、ポリソルベート80、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油60など）、ポリエチレングリコール、カルボキシメチルセルロース、アルギン酸ナトリウムなど）、保存剤（例、メチルパラベン、プロピルパラベン、ベンジルアルコール、クロロブタノール、フェノールなど）、等張化剤（例、塩化ナトリウム、グリセリン、D-マンニトール、D-ソルビトール、ブドウ糖など）などと共に水性溶剤（例、蒸留水、生理的食塩水、リンゲル液等）あるいは油性溶剤（例、オリーブ油、ゴマ油、綿実油、トウモロコシ油などの植物油、プロピレングリコール等）などに溶解、懸濁あるいは乳化することにより製造される。この際、所望により溶解補助剤（例、サリチル酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等）、安定剤（例、ヒト血清アルブミン等）、無痛化剤（例、ベンジルアルコール等）等の添加物を用いてもよい。

【0013】(6) 治療される疾患

本発明の結晶はアセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する。したがって、本発明の結晶および本発明の医薬組成物は、老年期痴呆症の予防・治療剤として用いることができる。また、本発明の結晶および本発明の医薬組成物は、例えば膀胱排出力改善剤として用いることがで

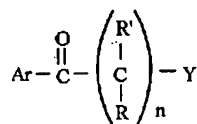
きる。例えば、以下の1)から6)等に起因する排尿障害、特に排尿困難の予防・治療剤として用いることができる。1)前立腺肥大症、2)膀胱頸部閉鎖症、3)神経因性膀胱、4)糖尿病、5)手術、6)低緊張性膀胱、および7)シェーグレン症候群(ドライアイ、ドライマウス、瞳乾燥等)。より具体的には、前立腺肥大による低緊張膀胱、糖尿病による低緊張膀胱、糖尿病性神経障害による低緊張膀胱、特発性低緊張膀胱(加齢によるものを含む)、多発性硬化症による低緊張膀胱、パーキンソン病による低緊張膀胱、脊髄損傷による低緊張膀胱、手術後の低緊張膀胱、脳閉塞による低緊張膀胱、糖尿病による神経因性膀胱、糖尿病性神経障害による神経因性膀胱、多発性硬化症による神経因性膀胱、パーキンソン病による神経因性膀胱、脊髄損傷による神経因性膀胱、脳閉塞による神経因性膀胱などによる排尿困難の予防・治療剤として用いることができる。さらに、本発明の結晶および本発明の医薬組成物は、頻尿、尿失禁等の排尿障害の予防・治療剤としても用いることができる。

【0014】(7)他の剤との組み合わせ利用

本発明の結晶は、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物の一種である。本発明の結晶を含む、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物類と、排尿障害(例えば、排尿困難等)を引き起こす疾患を治療する薬剤もしくは他の疾患治療のために投与されるがそれ自体が排尿障害(例えば、排尿困難等)を惹起する薬剤とを組み合わせ用いることができる。そのような「アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物」としては、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有し、分子内にカルバメート構造(—OCON—)を有さず、アンモニアの水素原子を炭化水素基で置換した化合物であればよく、好ましくは、第一アミン化合物、第二アミン化合物、第三アミン化合物である。さらに好ましくは、以下に記載する1)~49)の化合物等が列記される。これらの化合物のうち、少なくとも1個の5ないし7員含窒素複素環を部分構造として有する化合物等が好ましく、中でも後述の1)、20)、23)、41)、42)および43)の化合物等が好ましく、1)の化合物等が特に好ましい。

【0015】1)式

【化1】



〔式中、Arは縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい、nは1ないし10の整数、RおよびR'はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子または置換基を有していてもよい炭化水素基、Yは

置換基を有していてもよいアミノ基または置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基を示す。〕で表される化合物(以下、化合物(I)と略記することもある)またはその塩。

【0016】上記式中、Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」の「置換基」としては、例えば、(i)ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(ii)ハロゲン原子(例えば、フルオロ、クロル、ブロム、ヨード等)、(iii)低級アルキレンジオキシ基(例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ等のC₁-3アルキレンジオキシ基等)、(iv)ニトロ基、(v)シアノ基、(vi)ヒドロキシ基、(vii)ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii)シクロアルキル基(例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等のC₃-6シクロアルキル基等)、(ix)ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(x)アミノ基、(xi)モノ-低級アルキルアミノ基(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ-C₁-6アルキルアミノ基等)、(xii)ジ-低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ-C₁-6アルキルアミノ基等)、(xiii)5ないし7員環状アミノ基(例えば、1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子および硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基(例、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等)等)、(xiv)低級アルキル-カルボニルアミノ基(例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等のC₁-6アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xv)低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、プロピルスルホニルアミノ等のC₁-6アルキルスルホニルアミノ基等)、(xvi)低級アルコキシ-カルボニル基(例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソブトキシカルボニル等のC₁-6アルコキシ-カルボニル基等)、(xvii)カルボキシ基、(xviii)低級アルキル-カルボニル基(例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、ブチルカルボニル等のC₁-6アルキル-カルボニル基等)、(xix)シクロアルキル-カルボニル基(例えば、シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル等のC₃-6シクロアルキル-カルボニル基等)、(xx)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xxi)モノ-低級アルキル-カルバモイル基(例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、プロピルカルバモイル、ブチルカルバモイル等のモノ-C₁-6アルキル-カルバモイル基等)(xxii)ジ-低級アルキル-カルバモイル基(例えば、ジエチルカルバモイル、ジブチル

カルバモイル等のジ- C_1-6 アルキル-カルバモイル基等)、(xxiii)低級アルキルスルホニル基(例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル等の C_1-6 アルキルスルホニル基等)、(xxiv)シクロアルキルスルホニル基(例えば、シクロペンチルスルホニル、シクロヘキシルスルホニル等の C_3-6 シクロアルキルスルホニル等)、(xxv)フェニル基、(xxvi)ナフチル基、(xxvii)モノ-フェニル-低級アルキル基(例えばベンジル、フェニルエチル等のモノ-フェニル- C_1-6 アルキル基等)、(xxviii)ジ-フェニル-低級アルキル基(例えば、ジフェニルメチル、ジフェニルエチル等のジ-フェニル- C_1-6 アルキル基等)、(xxix)モノ-フェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基(例えばフェニルメチルカルボニルオキシ、フェニルエチルカルボニルオキシ等のモノ-フェニル- C_1-6 アルキル-カルボニルオキシ基等)、(xxx)ジ-フェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基(例えば、ジフェニルメチルカルボニルオキシ、ジフェニルエチルカルボニルオキシ等のジ-フェニル- C_1-6 アルキル-カルボニルオキシ基等)、(xxxi)フェノキシ基、(xxxii)モノ-フェニル-低級アルキル-カルボニル基(例えばフェニルメチルカルボニル、フェニルエチルカルボニル等のモノ-フェニル- C_1-6 アルキル-カルボニル基等)、(xxxiii)ジ-フェニル-低級アルキル-カルボニル基(例えば、ジフェニルメチルカルボニル、ジフェニルエチルカルボニル等のジ-フェニル- C_1-6 アルキル-カルボニル基等)、(xxxiv)ベンゾイル基、(xxxv)フェノキシカルボニル基、(xxxvi)フェニル-低級アルキル-カルバモイル基(例えば、フェニル-メチルカルバモイル、フェニル-エチルカルバモイル等のフェニル- C_1-6 アルキル-カルバモイル基等)、(xxxvii)フェニルカルバモイル基、(xxxviii)フェニル-低級アルキル-カルボニルアミノ基(例えば、フェニル-メチルカルボニルアミノ、フェニル-エチルカルボニルアミノ等のフェニル- C_1-6 アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xxxix)フェニル-低級アルキルアミノ基(例えば、フェニル-メチルアミノ、フェニル-エチルアミノ等のフェニル- C_1-6 アルキルアミノ基等)、(xxxx)フェニル-低級アルキルスルホニル基(例えば、フェニル-メチルスルホニル、フェニル-エチルスルホニル等のフェニル- C_1-6 アルキルスルホニル基等)、(xxxxi)フェニルスルホニル基、(xxxxii)フェニル-低級アルキルスルフィニル基(例えば、フェニル-メチルスルフィニル、フェニル-エチルスルフィニル等のフェニル- C_1-6 アルキルスルフィニル基等)、(xxxxiii)フェニル-低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、フェニル-メチルスルホニルアミノ、フェニル-エチルスルホニルアミノ等のフェニル- C_1-6 アルキルスルホニルアミノ基等)および(xxxxiv)フェニルスル

ホニルアミノ基(上記(xxv)ないし(xxxxiv)のフェニル基、ナフチル基、モノ-フェニル-低級アルキル基、ジ-フェニル-低級アルキル基、モノ-フェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基、ジ-フェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基、フェノキシ基、モノ-フェニル-低級アルキル-カルボニル基、ジ-フェニル-低級アルキル-カルボニル基、ベンゾイル基、フェノキシカルボニル基、フェニル-低級アルキル-カルバモイル基、フェニルカルバモイル基、フェニル-低級アルキル-カルボニルアミノ基、フェニル-低級アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、フェニル-低級アルキルスルフィニル基、フェニル-低級アルキルスルホニルアミノ基およびフェニルスルホニルアミノ基は、さらに、例えば、低級アルキル基(例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル等の C_1-6 アルキル等)、低級アルコキシ基(例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ等の C_1-6 アルコキシ等)、ハロゲン原子(例えば、クロル、ブロム、ヨード等)、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基、アミノ基、モノ-低級アルキルアミノ基(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ- C_1-6 アルキルアミノ等)、ジ-低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ- C_1-6 アルキルアミノ等)、ニトロ基、低級アルキル-カルボニル基(例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、ブチルカルボニル等の C_1-6 アルキル-カルボニル等)、ベンゾイル基等から選ばれた1ないし4個の置換基を有していてもよい。)等が挙げられる。該フェニル基はこれらの置換基を1ないし4個有していてもよい。

【0017】上記の「ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基」としては、例えば、1ないし3個のハロゲン原子(例えば、クロル、ブロム、ヨード等)を有していてもよい低級アルキル基(例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル等の C_1-6 アルキル基等)等が挙げられ、具体例としては、メチル、クロロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、エチル、2-ブロモエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、プロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、イソプロピル、ブチル、4, 4, 4-トリフルオロブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、5, 5, 5-トリフルオロペンチル、ヘキシル、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル等が挙げられる。上記の「ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基」としては、例えば、1ないし3個のハロゲン原子(例えば、クロル、ブロム、ヨード等)を有していてもよい低級アルコ

キシ基(例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ等のC₁-6アルコキシ基等)等が挙げられ、具体例としては、例えばメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、エトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、4, 4, 4-トリフルオロブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ等が挙げられる。上記の「ハロゲン化されているもよい低級アルキルチオ基」としては、例えば、1ないし3個のハロゲン原子(例えば、クロル、ブロム、ヨード等)を有しているもよい低級アルキルチオ基(例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ等のC₁-6アルキルチオ基等)等が挙げられ、具体例としては、メチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、4, 4, 4-トリフルオロブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ等が挙げられる。

【0018】「縮合しているもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有しているもよい」の「置換基」として好ましくは、(i) アミノ基、(ii) モノ-低級アルキルアミノ基(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ-C₁-6アルキルアミノ基等)、(iii) ジ-低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ-C₁-6アルキルアミノ基等)、(iv) 例えば1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子および硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有しているもよい5ないし7員環状アミノ基(例えば、ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、チオモルホリン等)、(v) 低級アルキル-カルボニルアミノ基(例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等のC₁-6アルキル-カルボニルアミノ基等)、(vi) 低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、プロピルスルホニルアミノ等のC₁-6アルキルスルホニルアミノ基等)、(vii) フェニル-低級アルキルアミノ(例えば、フェニル-メチルアミノ、フェニル-エチルアミノ等のフェニル-C₁-6アルキルアミノ等)、(viii) フェニル-低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、フェニル-メチルスルホニルアミノ、フェニル-エチルスルホニルアミノ等のフェニル-C₁-6アルキル-スルホニルアミノ基等)、(ix) フェニルスルホニルアミノ基、(x) ハロゲン原子(例えば、フルオロ、クロル等)、(xi) ハロゲン化されているもよい低級アルキル基(例えば、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、トリフルオロメチル等)および(xii) ハロゲン化されていて、

もよい低級アルコキシ基(例えば、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、tert-ブトキシ、トリフルオロメトキシ等)等が挙げられ、特に、ジ-低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ-C₁-6アルキルアミノ基等)、1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子および硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有しているもよい5ないし7員環状アミノ基(例えば、ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、チオモルホリン等)等が好ましい。該「縮合しているもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有しているもよい」の「フェニル基」が縮合する例としては、例えば、(1) 置換基を有しているもよい単環式複素環と縮合する場合、(2) 置換基を有しているもよい2環式複素環と縮合する、あるいは2つの同一または異なる単環(但し、少なくとも一方の環が単環式複素環である)と縮合する場合、および(3) 置換基を有しているもよい3環式複素環と縮合する場合等が挙げられる。

【0019】上記(1)の「縮合しているもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有しているもよい」のフェニル基が単環式複素環と縮合する場合の具体例としては、例えば、式

【化2】



〔式中、A環は置換基を有しているもよいベンゼン環、およびB環は置換基を有しているもよい複素環を示す。〕で表される基等が挙げられる。A環の置換基としては、上記の「縮合しているもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有しているもよい」の「置換基」等が挙げられ、その置換基数は1ないし3個である。

【0020】B環で示される「置換基を有しているもよい複素環」の「複素環」としては、例えば、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む4ないし14員(好ましくは5ないし9員)芳香族または非芳香族複素環等が挙げられる。具体的には例えば、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、イミダゾール、フラン、チオフェン、ジヒドロピリジン、ジアゼピン、オキサゼピン、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン、ピロール、ピラゾール、1, 2, 3-トリアゾール、オキサゾール、オキサゾリジン、チアゾール、チアゾリジン、イソオキサゾール、イミダゾリン等が挙げられる。このうち、1個のヘテロ原子あるいは同一または異なる2個のヘテロ原子を含有する5ないし9員環の非芳香族複素環(例えば、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピ

ペラジン、ホモビペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン等)等が好ましい。特に、①例えば窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる1個のヘテロ原子を含有する非芳香族複素環、②1個の窒素原子と窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる1個のヘテロ原子とを含有する非芳香族複素環等が好ましい。B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」としては、例えば (i) ハロゲン原子 (例えば、フルオロ、クロル、ブロム、ヨード等)、(ii) ニトロ基、(iii) シアノ基、(iv) オキソ基、(v) ヒドロキシ基、(vi) 低級アルキル基 (例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル等のC₁-6アルキル基等) (vii) 低級アルコキシ基 (例えば、メトキシ、エトキシ、プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、ブチルオキシ等のC₁-6アルコキシ基等)、(viii) 低級アルキルチオ基 (例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ等のC₁-6アルキルチオ基等)、(ix) アミノ基、(x) モノ-低級アルキルアミノ基 (例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ-C₁-6アルキルアミノ基等)、(xi) ジ-低級アルキルアミノ基 (例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ-C₁-6アルキルアミノ基等)、(xii) 例えば炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子および硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基 (例えば、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等)、(xiii) 低級アルキル-カルボニルアミノ基 (例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等のC₁-6アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xiv) 低級アルキルスルホニルアミノ基 (例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ等のC₁-6アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xv) 低級アルコキシ-カルボニル基 (例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル等のC₁-6アルコキシ-カルボニル基等)、(xvi) カルボキシ基、(xvii) 低級アルキルカルボニル基 (例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル等のC₁-6アルキル-カルボニル基等)、(xviii) カルバモイル基、(xix) モノ-低級アルキルカルバモイル基 (例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル等のモノ-C₁-6アルキル-カルバモイル基等)、(xx) ジ-低級アルキルカルバモイル基 (例えば、ジメチルカルバモイル、ジエチルカルバモイル等のジ-C₁-6アルキル-カルバモイル基等)、(xxi) 低級アルキルスルホニル基 (例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル等のC₁-6アルキルスルホニル基等)等から選ばれた1ないし5個が用いられる。中でも、オキソ基、低級アルキル基 (例えば、

メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル等のC₁-6アルキル基等)等が好ましい。特にオキソ基等が好ましい。

【0021】B環が環中に窒素原子を有する場合、例えば、B環は環中に式

$>N-R^1$

〔式中、R¹は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、アシル基または置換基を有していてもよい複素環基を示す。〕で表される基を有していてもよい。さらに、B環は上記置換基 (i) ないし (xxi) を1ないし3個有していてもよい。R¹で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「炭化水素基」は、炭化水素化合物から水素原子を1個除いた基を示し、その例としては、例えば以下のアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、アリール基、アラールキル基、これらの組み合わせの基等が挙げられる。このうち、C₁-16炭化水素基等が好ましい。

(1) アルキル基 (例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル、ペンチル、ヘキシル等のC₁-6アルキル基等)

(2) アルケニル基 (例えば、ビニル、アリル、イソプロペニル、ブテニル、イソブテニル、sec-ブテニル等のC₂-6アルケニル基等)

(3) アルキニル基 (例えば、プロパルギル、エチニル、ブチニル、1-ヘキシニル等のC₂-6アルキニル基等)

(4) シクロアルキル基 (例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等のC₃-6シクロアルキル基等)

(5) 架橋環式低級飽和炭化水素基 (例えば、ビスクロ〔3.2.1〕オクト-2-イル、ビスクロ〔3.3.1〕ノン-2-イル、アダマンタン-1-イル等の架橋環式C₈-14飽和炭化水素基等)

(6) アリール基 (例えば、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、ビフェニル、2-インデニル、2-アンスリル等のC₆-14アリール基等、好ましくはフェニル基等)

(7) アラルキル基 (例えば、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル、フェニルブチル、フェニルペンチル、フェニルヘキシル等のフェニル-C₁-10アルキル; α-ナフチルメチル等のナフチル-C₁-6アルキル; ジフェニルメチル、ジフェニルエチル等のジフェニル-C₁-3アルキル等のC₇-16アラルキル基等)

(8) アリール-アルケニル基 (例えばスチリル、シンナミル、4-フェニル-2-ブテニル、4-フェニル-3-ブテニル等のフェニル-C₂-12アルケニル等のC₆-14アリール-C₂-12アルケニル基等)

(9) アリール-C₂-12アルキニル基 (例えば、フ

フェニルエチニル、3-フェニル-2-プロピニル、3-フェニル-1-プロピニル等のフェニル-C₂-1,2アルキニル等のC₆-1,4アリール-C₂-1,2アルキニル基等)

(10) シクロアルキル-アルキル基(例えば、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘプチルメチル、シクロオクチルメチル、シクロノニルメチル、シクロデシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルペンチル、シクロヘキシルヘキシル、シクロヘキシルヘキシル等のC₃-7シクロアルキル-C₁-6アルキル基等)

(11) アリール-アリール-C₁-10アルキル基(例えばビフェニルメチル、ビフェニルエチル等)

【0022】R¹で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「炭化水素基」の好ましいものとしては、例えば、C₁-6アルキル基、C₃-6シクロアルキル基、C₇-16アラールキル基等である。さらに好ましくはC₇-10アラールキル基(例えば、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル等のフェニル-C₁-4アルキル等)等である。R¹で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「置換基」としては、例えば、(i)ハロゲン原子(例えば、フルオロ、クロル、ブロム、ヨード等)、(ii)ニトロ基、(iii)シアノ基、(iv)オキソ基、(v)ヒドロキシ基、(vi)ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(vii)ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii)ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(ix)アミノ基、(x)モノ-低級アルキルアミノ基(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ-C₁-6アルキルアミノ基等)、(xi)ジ-低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ-C₁-6アルキルアミノ基等)、(xii)例えば炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子および硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基(例えば、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等)、(xiii)低級アルキル-カルボニルアミノ基(例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等のC₁-6アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xiv)低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ等のC₁-6アルキル-

スルホニルアミノ基等)、(xv)低級アルコキシ-カルボニル基(例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル等のC₁-6アルコキシ-カルボニル基等)、(xvi)カルボキシ基、(xvii)低級アルキル-カルボニル基(例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル等のC₁-6アルキル-カルボニル基等)、(xviii)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xix)モノ-低級アルキル-カルバモイル基(例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル等のモノ-C₁-6アルキル-カルバモイル基等)、(xx)ジ-低級アルキル-カルバモイル基(例えば、ジメチルカルバモイル、ジエチルカルバモイル等のジ-C₁-6アルキル-カルバモイル基等)、(xxi)低級アルキルスルホニル基(例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル等のC₁-6アルキルスルホニル基等)、(xxii)低級アルコキシ-カルボニル-低級アルキル基(例えば、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、tert-ブトキシカルボニルメチル、メトキシカルボニルエチル、メトキシカルボニルメチル、メトキシカルボニル(ジメチル)メチル、エトキシカルボニル(ジメチル)メチル等のC₁-6アルキル-カルボニル-C₁-6アルキル基等)、(xxiii)カルボキシ-低級アルキル基(例えば、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシ(ジメチル)メチル等のカルボキシ-C₁-6アルキル基等)、(xxiv)置換基を有していてもよい複素環基、(xxv)C₆-1,4アリール基(例えば、フェニル、ナフチル等)、(xxvi)C₇-16アラールキル基(例えば、ベンジル等)、(xxvii)置換基を有していてもよいウレイド基(例えば、ウレイド、3-メチルウレイド、3-エチルウレイド、3-フェニルウレイド、3-(4-フルオロフェニル)ウレイド、3-(2-メチルフェニル)ウレイド、3-(4-メトキシフェニル)ウレイド、3-(2,4-ジフルオロフェニル)ウレイド、3-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]ウレイド、3-ベンジルウレイド、3-(1-ナフチル)ウレイド、3-(2-ビフェニル)ウレイド等)、(xxviii)置換基を有していてもよいチオウレイド基(例えば、チオウレイド、3-メチルチオウレイド、3-エチルチオウレイド、3-フェニルチオウレイド、3-(4-フルオロフェニル)チオウレイド、3-(4-メチルフェニル)チオウレイド、3-(4-メトキシフェニル)チオウレイド、3-(2,4-ジクロロフェニル)チオウレイド、3-ベンジルチオウレイド、3-(1-ナフチル)チオウレイド等)、(xxix)置換基を有していてもよいアミジノ基(例えば、アミジノ、N¹-メチルアミジノ、N¹-エチルアミジノ、N¹-フェニルアミジノ、N¹, N¹-ジメチルアミジノ、N¹, N²-ジメチルアミジノ、N¹-メ-

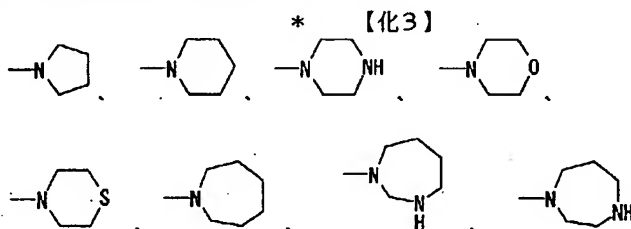
チル-N¹-エチルアミノ、N¹、N¹-ジエチルアミノ、N¹-メチル-N¹-フェニルアミノ、N¹、N¹-ジ(4-ニトロフェニル)アミノ等)、(xxx)置換基を有していてもよいグアニジノ基(例えば、グアニジノ、3-メチルグアニジノ、3,3-ジメチルグアニジノ、3,3-ジエチルグアニジノ等)、(xxxi)置換基を有していてもよい環状アミノカルボニル基(例えば、ピロリジノカルボニル、ピペリジノカルボニル、(4-メチルピペリジノ)カルボニル、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル、(4-ベンジルピペリジノ)カルボニル、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル、[4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル、(4-メチルピペラジノ)カルボニル、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル、[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジノ]カルボニル、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル、モルホリノカルボニル、チオモルホリノカルボニル等)、(xxxii)置換基を有していてもよいアミノチオカルボニル基(例えば、アミノチオカルボニル、メチルアミノチオカルボニル、ジメチルアミノチオカルボニル等)、(xxxiii)置換基を有していてもよいアミノスルホニル基(例えば、アミノスルホニル、メチルアミノスルホニル、ジメチルアミノスルホニル等)、(xxxiv)置換基を有していてもよいフェニルスルホニルアミノ(例えば、フェニルスルホニルアミノ、(4-メチルフェニル)スルホニルアミノ、(4-クロロフェニル)スルホニルアミノ、(2,5-ジクロロフェニル)スルホニルアミノ、(4-メトキシフェニル)スルホニルアミノ、(4-アセチルアミノフェニル)スルホニルアミノ、(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ等)、(xxxv)スルホ基、(xxxvi)スルフィノ基、(xxxvii)スルフェノ基、(xxxviii)C₁-6アルキルスルホ基(例えば、メチルスルホ、エチルスルホ、プロピルスルホ等)、(xxxix)C₁-6アルキルスルフィノ基(例えば、メチルスルフィノ、エチルスルフィノ、プロピルスルフィノ等)、(xxxx)C₁-6アルキルスルフェノ基(例えば、メチルスルフェノ、エチルスルフェノ、プロピルスルフェノ等)、(xxxxi)ホスホ基、(xxxxii)ジ-C₁-6アルコキシホスホリル基(例えば、ジメトキシホスホリル、ジエトキシホスホリル、ジプロポキシホスホリル等)等から選ばれた1ないし5個(好ましくは1ないし3個)が挙げられる。このうち好ましくは、ハロゲン原子、ハロゲン化されていてもよいアルキル基、ハロゲン化されていてもよいアルコキシ基、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、カルボキシ基、C₁-6アルコキシ-カルボニル基、カルバモイル基、アミノチオカルボニル基、モノ-C₁-6アルキル-カルバモイル基、ジ-C₁-6アルキル-カルバモイル基、アミノ基、モノ-C₁-6アルキルアミノ基、ジ-C₁-6アルキルアミノ基、5ないし7員環状アミノ基、C₁-6

アルキル-カルボニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、C₁-6アルキルスルホニルアミノ基等が挙げられる。

【0023】上記「置換基を有していてもよい複素環基」の「複素環基」としては、例えば、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子1ないし6個(好ましくは1ないし4個)を含む5ないし14員(単環式または2ないし4環式)複素環から水素原子を1個除去してできる基等が用いられる。単環式複素環基としては、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、イミダゾール、フラン、チオフェン、ジヒドロピリジン、ジアゼピン、オキサゼピン、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン、ピロール、ピラゾール、1,2,3-トリアゾール、オキサゾール、オキサゾリジン、チアゾール、チアゾリジン、イソオキサゾール、イミダゾリン、トリアゾール、チアジアゾール、オキサジアゾール、オキサチアジアゾール、トリアジン、テトラゾール等の単環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が挙げられる。2環式複素環としては、例えば、インドール、ジヒドロインドール、イソインドール、ジヒドロイソインドール、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、ベンズイミダゾール、ベンズオキサゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンズチアゾール、インダゾール、キノリン、テトラヒドロキノリン、イソキノリン、テトラヒドロイソキノリン、テトラヒドロ-1H-1-ベンズアゼピン、テトラヒドロ-1H-2-ベンズアゼピン、テトラヒドロ-1H-3-ベンズアゼピン、テトラヒドロベンズオキサゼピン、キナゾリン、テトラヒドロキナゾリン、キノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンズチアジン、イミダゾピリジン等の2環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が用いられる。3または4環式複素環基としては、アクリジン、テトラヒドロアクリジン、ピロロキノリン、ピロロインドール、シクロペントインドール、イソインドロベンズアゼピン等の3または4環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が挙げられる。

【0024】該「複素環基」としては、単環または2環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が好ましい。該「置換基を有していてもよい複素環基」の「置換基」としては上記B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」が挙げられ、その置換基数は1ないし5個である。R¹で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」として好ましくは、ハロゲン原子、C₁-6アルキル、C₁-6アルコキシ、ニトロ、シアノおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいC₇-16アラルキル基(好ましくはベンジル等)等が挙げられる。上記R¹で示さ

れる「アシル基」としては、例えば、式： $-(C=O)-R^2$ 、 $-(C=O)-OR^2$ 、 $-(C=O)-NR^2R^3$ 、 $-SO_2-R^2$ 、 $-SO-R^2$ 、 $-(C=S)-OR^2$ または $-(C=S)NR^2R^3$ 〔式中、 R^2 および R^3 はそれぞれ (i) 水素原子、(ii) 置換基を有しているもよい炭化水素基または (iii) 置換基を有しているもよい複素環基を示すか、 R^2 と R^3 とは互いに結合して隣接する窒素原子と共に置換基を有しているもよい含窒素環基を形成してもよい。〕で表されるアシル基等が挙げられる。このうち好ましくは、式： $-(C=O)-R^2$ または $-(C=O)-NR^2R^3$ 〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表されるアシル基である。

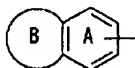


で表される基等が挙げられる。

【0026】該「置換基を有しているもよい含窒素環基」の「置換基」としては、上記B環で示される「置換基を有しているもよい複素環」の「置換基」と同様のものが挙げられ、その置換基数は1ないし5個である。 R^2 および R^3 として、好ましくは、(i) 水素原子、(ii) ハロゲン化されているもよい C_1-6 アルキル、(iii) C_1-6 アルキルおよび C_1-6 アルコキシから選ばれる置換基を1ないし3個有しているもよい C_6-10 アリール、(iv) C_7-16 アラルキル (例、ベンジル等)、(v) 5または6員複素環基 (例、ピリジル、チエニル、フリル等) 等が挙げられる。上記 R^1 で示される「アシル基」として、好ましくは、ホルミル、ハロゲン化されているもよい C_1-6 アルキル-カルボニル (例、アセチル、トリフルオロアセチル、プロピオニル等)、5または6員複素環カルボニル (例、ピリジルカルボニル、チエニルカルボニル、フリルカルボニル等)、 C_6-14 アリール-カルボニル (例、ベンゾイル、1-ナフトイル、2-ナフトイル等)、 C_7-16 アラルキル-カルボニル (例、フェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル等)、 C_6-10 アリールスルホニル (例、ベンゼンスルホニル、ナフチルスルホニル等) 等が挙げられる。 R^1 は、好ましくは、水素原子、 C_1-6 アルキル、 C_1-6 アルキル-カルボニル、 C_6-14 アリール-カルボニル等である。

【0027】上記式

【化4】



* 【0025】 R^2 または R^3 で示される「置換基を有しているもよい炭化水素基」および「置換基を有しているもよい複素環基」は、上記 R^1 で示される「置換基を有しているもよい炭化水素基」および「置換基を有しているもよい複素環基」と同様のものがそれぞれ挙げられる。 R^2 と R^3 とで形成される「置換基を有しているもよい含窒素環基」としては、炭素原子および1個の窒素原子以外に、例えば窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有しているもよい5ないし9員 (好ましくは5ないし7員) の含窒素飽和複素環基等が挙げられる。より具体的には、例えば、式

【化3】

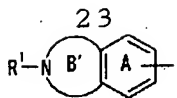
20※で表される基の具体例としては、2, 3-ジヒドロベンゾフラン; 3, 4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾチオピラン; 2, 3-ジヒドロ-1H-インドール; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン; 2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1-ベンズアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-2-ベンズアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-3-ベンズアゼピン等のベンズアゼピン; 1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-1-ベンズアゾシン、1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-2-ベンズアゾシン、1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-3-ベンズアゾシン等のベンズアゾシン; 2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-1-ベンズアゾニン、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-2-ベンズアゾニン、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-3-ベンズアゾニン、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-4-ベンズアゾニン等のベンズアゾニン; 2, 3-ジヒドロベンズオキサゾール等のベンズオキサゾール; 2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール等のベンゾチアゾール; 2, 3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール等のベンズイミダゾール; 3, 4-ジヒドロ-1H-2, 1-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 2-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 3-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-3, 1-ベンズオキサジン等のベンズオキサジン; 3, 4-ジヒドロ-1H-2, 1-ベンゾチアジン、3, 4-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンゾチアジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 2-ベンゾチアジン、3, 4-ジヒドロ-2H-

21

1, 4-ベンゾチアジン、3, 4-ジヒドロ-2H-
 1, 3-ベンゾチアジン、3, 4-ジヒドロ-2H-
 3, 1-ベンゾチアジン等のベンゾチアジン; 1, 2,
 3, 4-テトラヒドロシンノリン、1, 2, 3, 4-テ
 トラヒドロフタラジン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ
 キナゾリン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノキサリ
 ン等のベンゾジアジン; 3, 4-ジヒドロ-1, 2-ベン
 ズオキサチン、3, 4-ジヒドロ-2, 1-ベンズ
 オキサチン、2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンズオキ
 サチン、1, 4-ジヒドロ-2, 3-ベンズオキサチ
 ン、4H-1, 3-ベンズオキサチン、4H-3, 1-
 ベンズオキサチン等のベンズオキサチン; 3,
 4-ジヒドロ-1, 2-ベンゾジオキシン、2, 3-ジ
 ヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシン、1, 4-ジヒドロ
 -2, 3-ベンゾジオキシン、4H-1, 3-ベンゾジ
 オキシン等のベンゾジオキシン; 3, 4-ジヒドロ
 -1, 2-ベンズジチン、2, 3-ジヒドロ-1, 4-
 ベンズジチン、1, 4-ジヒドロ-2, 3-ベンズジ
 チン、4H-1, 3-ベンズジチン等のベンズジチ
 ン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 2-ベンズ
 オキサゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 3-
 ベンズオキサゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ
 -1, 4-ベンズオキサゼピン、2, 3, 4, 5-テ
 トラヒドロ-1, 5-ベンズオキサゼピン、1, 3, 4,
 5-テトラヒドロ-2, 1-ベンズオキサゼピン、1,
 3, 4, 5-テトラヒドロ-2, 3-ベンズオキサゼピ
 ン、1, 3, 4, 5-テトラヒドロ-2, 4-ベンズオ
 キサゼピン、1, 2, 4, 5-テトラヒドロ-3, 1-
 ベンズオキサゼピン、1, 2, 4, 5-テトラヒドロ
 -3, 2-ベンズオキサゼピン、1, 2, 3, 5-テトラ
 ヒドロ-4, 1-ベンズオキサゼピン等のベンズオキサ
 ゼピン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 2-ベン
 ゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 4-
 ベンゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ
 -1, 5-ベンゾチアゼピン、1, 3, 4, 5-テトラ
 ヒドロ-2, 1-ベンゾチアゼピン、1, 3, 4, 5-テ
 トラヒドロ-2, 4-ベンゾチアゼピン、1, 2, 4,
 5-テトラヒドロ-3, 1-ベンゾチアゼピン、1,
 2, 4, 5-テトラヒドロ-3, 2-ベンゾチアゼピ
 ン、1, 2, 3, 5-テトラヒドロ-4, 1-ベンゾチ
 アゼピン等のベンゾチアゼピン; 2, 3, 4, 5-テ
 トラヒドロ-1H-1, 2-ベンゾチアゼピン、2, 3,
 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 3-ベンゾチアゼピ
 ン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 4-ベン
 ゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H
 -1, 5-ベンゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラ
 ヒドロ-1H-2, 3-ベンゾチアゼピン、2, 3,
 4, 5-テトラヒドロ-1H-2, 4-ベンゾチアゼピ
 ン等のベンゾチアゼピン; 4, 5-ジヒドロ-1, 3-
 ベンゾジオキセピン、4, 5-ジヒドロ-3H-1, 2

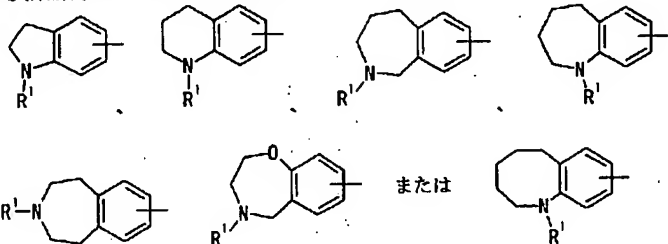
22

-ベンゾジオキセピン、2, 3-ジヒドロ-5H-1,
 4-ベンゾジオキセピン、3, 4-ジヒドロ-2H-
 1, 5-ベンゾジオキセピン、4, 5-ジヒドロ-1H
 -2, 3-ベンゾジオキセピン、1, 5-ジヒドロ-
 2, 4-ベンゾジオキセピン等のベンゾジオキセピン;
 4, 5-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンゾチエピン、
 1, 5-ジヒドロ-2, 4-ベンゾチエピン、3, 4-
 ジヒドロ-2H-1, 5-ベンゾチエピン、2, 3-
 ジヒドロ-5H-1, 4-ベンゾチエピン等のベン
 ゾチエピン、3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-
 1, 5-ベンズオキサゾシン、3, 4, 5, 6-テトラ
 ヒドロ-2H-1, 6-ベンズオキサゾシン等のベンズ
 オキサゾシン; 3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-
 1, 5-ベンゾチアゾシン、3, 4, 5, 6-テトラ
 ヒドロ-2H-1, 6-ベンゾチアゾシン等のベンゾチ
 アゾシン; 1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-1,
 6-ベンゾジアゾシン等のベンゾジアゾシン; 2, 3,
 4, 5-テトラヒドロ-1, 6-ベンズオキサチオシ
 ン等のベンズオキサチオシン; 2, 3, 4, 5-テトラ
 ヒドロ-1, 6-ベンゾジオキソシン等のベンゾジオキ
 ソシン; 1, 3, 5-ベンゾトリオキセピン、5H-1,
 3, 4-ベンゾトリオキセピン等のベンゾトリオキセピ
 ン; 3, 4-ジヒドロ-1H-5, 2, 1-ベンズオキ
 サチアゼピン、3, 4-ジヒドロ-2H-5, 1, 2-
 ベンズオキサチアゼピン、4, 5-ジヒドロ-3, 1,
 4-ベンズオキサチアゼピン、4, 5-ジヒドロ-3H
 -1, 2, 5-ベンズオキサチアゼピン等のベンズオキ
 サチアゼピン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1,
 3, 4-ベンズオキサジアゼピン等のベンズオキサジ
 アゼピン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 3, 5-
 ベンズチアジアゼピン等のベンズチアジアゼピン; 2,
 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 2, 5-ベンゾ
 トリアゼピン等のベンゾトリアゼピン; 4, 5-ジヒ
 ドロ-1, 3, 2-ベンゾオキサチエピン、4, 5-ジヒ
 ドロ-1H-2, 3-ベンズオキサチエピン、3, 4-
 ジヒドロ-2H-1, 5-ベンズオキサチエピン、4,
 5-ジヒドロ-3H-1, 2-ベンズオキサチエピン、
 4, 5-ジヒドロ-3H-2, 1-ベンズオキサチエピ
 ン、2, 3-ジヒドロ-5H-1, 4-ベンズオキサチ
 エピン、2, 3-ジヒドロ-5H-4, 1-ベンズオキ
 サチエピン等、とりわけ2, 3, 4, 5-テトラヒドロ
 -1H-3-ベンズアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒド
 ロ-1H-2-ベンズアゼピン、2, 3-ジヒドロ-1
 H-インドール、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 4-
 ベンズオキサゼピン等の2環式縮合ベンゼン環から水素
 原子を1個除去してできる基等が挙げられる。
 【0028】このうち、好ましい例としては式
 【化5】



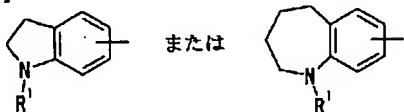
〔式中、B'環はオキシ基でさらに置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環、その他の各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基等が挙げられる。

【0029】該「オキシ基でさらに置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」の「5ないし9員の含窒素複素環」としては、炭素原子および1個の窒素原子*



〔式中、R¹は上記と同意義を示す。〕で表される基等が挙げられる。特に好ましくは、式

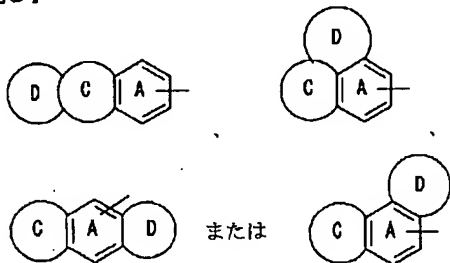
【化7】



〔式中、R¹は上記と同意義を示す。〕で表される基等が挙げられる。

【0030】上記(2)の「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」のフェニル基が置換基を有していてもよい2環式複素環と縮合する、あるいは2つの同一または異なる単環(但し、少なくとも一方の環が単環式複素環である)と縮合する場合の具体例としては、例えば、式

【化8】

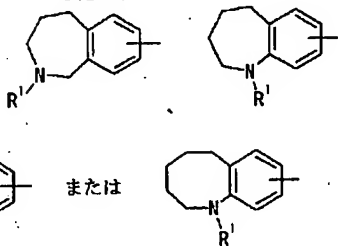


〔式中、A環は上記と同意義、C環およびD環の一方は置換基を有していてもよい複素環、他方は置換基を有していてもよい5ないし9員環を示す。〕で表される基等が挙げられる。

【0031】C環またはD環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「複素環」としては、B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」が挙げられる。C環またはD環で示される「置換基を有していてもよい5ないし9員環」の「5ないし9員環」は、窒素原

*以外に、例えば窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよい5ないし9員の含窒素複素環等が挙げられ、5ないし9員の非芳香族含窒素複素環(例えば、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、ビペラジン、ホモビペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン等)等が好ましく用いられる。このうち、より好ましい例としては、式

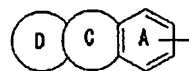
【化6】



※子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよく、例えば、5ないし9員複素環(例えば、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、イミダゾール、フラン、チオフェン、ジヒドロピリジン、ジアゼピン、オキサゼピン、ピロリジン、ビペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ビペラジン、ホモビペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン等)、5ないし9員炭素環(例えば、ベンゼン、シクロペンタン、シクロペンテン、シクロヘキサン、シクロヘキセン、シクロヘキサジエン、シクロヘプタン、シクロヘプテン、シクロヘプタジエン等)等が挙げられる。このうち、5ないし7員環が好ましい。中でも、ベンゼン、シクロヘキサン等が好ましい。「置換基を有していてもよい5ないし9員環」の「置換基」としては、上記B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」と同様のものが挙げられる。

【0032】上記式

【化9】



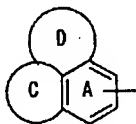
40 〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、カルバゾール、1, 2, 3, 4, 4a, 9a-ヘキサヒドロカルバゾール、9, 10-ジヒドロアクリジン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロアクリジン、10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンズ(b, f)アゼピン、5, 6, 7, 12-テトラヒドロジベンズ(b, g)アゾシン、6, 11-ジヒドロ-5H-ジベンズ(b, e)アゼピン、6, 7-ジヒドロ-5H-ジベンズ(c, e)アゼピン、5, 6, 11, 12-テトラヒドロジベンズ(b, f)アゾシン、ジベンゾフラン、9H-キサンテン、10, 11-ジヒドロジベンズ

25

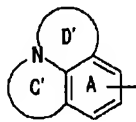
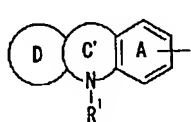
〔b, f〕オキセピン、6, 11-ジヒドロジベンズ
 〔b, e〕オキセピン、6, 7-ジヒドロ-5H-ジベンズ
 〔b, g〕オキソシン、ジベンゾチオフェン、9H-
 チオキサンテン、10, 11-ジヒドロジベンズ
 〔b, f〕チエピン、6, 11-ジヒドロジベンズ
 〔b, e〕チエピン、6, 7-ジヒドロ-5H-ジベンズ
 〔b, g〕チオシン、10H-フェノチアジン、10H-
 フェノキサジン、5, 10-ジヒドロフェナジン、
 10, 11-ジベンズ〔b, f〕〔1, 4〕チアゼピン、
 10, 11-ジヒドロジベンズ〔b, f〕〔1, 4〕
 オキサゼピン、2, 3, 5, 6, 11, 11a-ヘキサ
 ヒドロ-1H-ピロロ〔2, 1-b〕〔3〕ベンズ
 アゼピン、10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンズ
 〔b, e〕〔1, 4〕ジアゼピン、5, 11-ジヒドロ
 ジベンズ〔b, e〕〔1, 4〕オキサゼピン、5, 11-
 ジヒドロジベンズ〔b, f〕〔1, 4〕チアゼピン、
 10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンズ〔b, e〕
 〔1, 4〕ジアゼピン、1, 2, 3, 3a, 8, 8a-
 ヘキサヒドロピロロ〔2, 3-b〕インドール等の3環
 式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基
 が挙げられる。

【0033】上記式

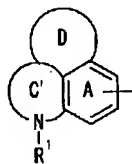
【化10】



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基
 の具体例としては、1H, 3H-ナフト〔1, 8-c
 d〕〔1, 2〕オキサジン、ナフト〔1, 8-de〕-
 1, 3-オキサジン、ナフト〔1, 8-de〕-1, 2-
 オキサジン、1, 2, 2a, 3, 4, 5-ヘキサヒド
 ロベンズ〔cd〕インドール、2, 3, 3a, 4, 5,
 6-ヘキサヒドロ-1H-ベンズ〔de〕キノリン、4
 H-ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン、1, 2,
 5, 6-テトラヒドロ-4H-ピロロ〔3, 2, 1-
 ij〕キノリン、5, 6-ジヒドロ-4H-ピロロ〔3,
 2, 1-ij〕キノリン、1H, 5H-ベンズ〔ij〕*



または



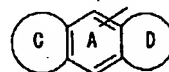
〔式中、C'環およびD'環は、それぞれオキソ基でさら
 に置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環、
 その他の各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基
 等が好ましい。このうち式
 【化14】

26

*キノリジン、アゼピノ〔3, 2, 1-hi〕インドール、
 1, 2, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロアゼピノ
 〔3, 2, 1-hi〕インドール、1H-ピリド〔3,
 2, 1-jk〕〔1〕ベンズアゼピン、5, 6, 7, 8-
 テトラヒドロ-1H-ピリド〔3, 2, 1-jk〕
 〔1〕ベンズアゼピン、1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサ
 ヒドロ-1H-ピリド〔3, 2, 1-jk〕〔1〕ベン
 ズアゼピン、2, 3-ジヒドロ-1H-ベンズ〔d
 e〕イソキノリン、1, 2, 3, 4, 4a, 5, 6, 7-
 オクタヒドロナフト〔1, 8-bc〕アゼピン、2,
 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-1H-ピリド
 〔3, 2, 1-jk〕〔1〕ベンズアゼピン等の3環式
 縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が
 挙げられる。

【0034】上記式

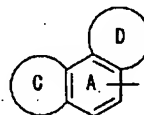
【化11】



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基
 の具体例としては、1, 2, 3, 5, 6, 7-ヘキサヒ
 ドロベンズ〔1, 2-b:4, 5-b'〕ジピロール、
 1, 2, 3, 5, 6, 7-ヘキサヒドロシクロペント
 〔f〕インドール等の3環式縮合ベンゼン環から水素原
 子を1個除去してできる基が挙げられる。

【0035】上記式

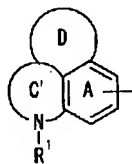
【化12】



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基
 の具体例としては、1, 2, 3, 6, 7, 8-ヘキサヒ
 ドロシクロペント〔e〕インドール、2, 3, 4, 7,
 8, 9-ヘキサヒドロ-1H-シクロペンタ〔f〕キノ
 リン等の3環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去
 してできる基が挙げられる。

【0036】このうち、式

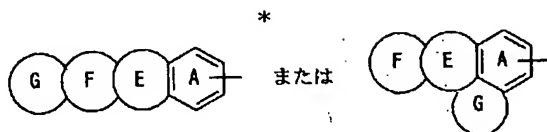
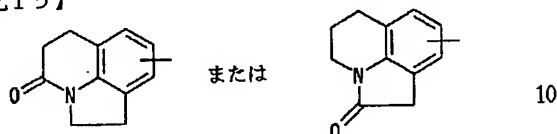
【化13】



※50 〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基

等がさらに好ましい。

【0037】C'環または0037D'環で示される「オキソ基でさらに置換されているもよい5ないし9員の含窒素複素環」は、B'環で示される「オキソ基でさらに置換されているもよい5ないし9員の含窒素複素環」と同様のものが挙げられる。中でもより好ましくは、式【化15】



〔式中、A環は上記と同意義、E環、F環およびG環の少なくとも一つの環は置換基を有しているもよい複素環、その他の環は置換基を有しているもよい5ないし9員環を示す。〕で表される基等が挙げられる。E環、F環またはG環で示される「置換基を有しているもよい複素環」および「置換基を有しているもよい5ないし9員※

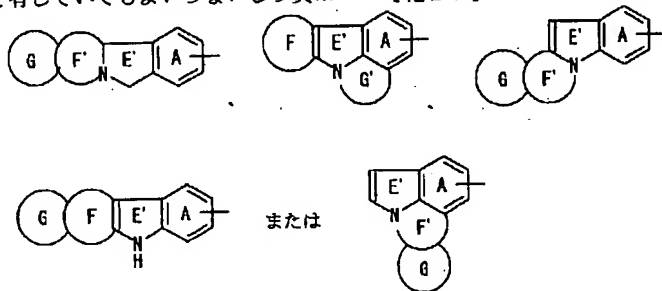
*で表される基等が挙げられる。

【0038】上記(3)の「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有しているもよい」のフェニル基が置換基を有しているもよい3環式複素環と縮合する場合の具体例としては、例えば、式【化16】

※環は、B環またはC環で示される「置換基を有しているもよい複素環」および「置換基を有しているもよい5ないし9員環」がそれぞれ挙げられる。

【0039】このうち、好ましくは

(i) 式
【化17】



〔式中、A環は上記と同意義、E'環、F'環およびG'環は、それぞれオキソ基でさらに置換されているもよい5ないし9員の含窒素複素環、および---は単結合または二重結合を示す。〕で表される基、

【0040】(ii) 例えば、フルオランテン、アセフェナントリレン、アセアントリレン、トリフェニレン、ピレン、クリセン、ナフタセン、プレリアデン、ベンゾ[a]アントラセン、インデノ[1,2-a]インデン、シクロペンタ[a]フェナントレン、ピリド[1',2':1,2]イミダゾ[4,5-b]キノキサリン、1H-2-オキサピレン、スピロ[ピペリジン-4,9'-キサンテン]等の環から水素原子を1個除去してできる基、およびこれらのジヒドロ体、テトラヒドロ体、ヘキサヒドロ体、オクタヒドロ体、デカヒドロ体等が挙げられる。E'環、F'環およびG'環で示される「オキソ基でさらに置換されているもよい5ないし9員の含窒素複素環」は、B'環で示される「オキソ基でさらに置換されているもよい5ないし9員の含窒素複素環」と同様のものが挙げられる。

★【0041】上記式
【化18】

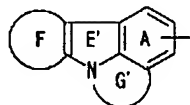


〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、2H-イソインドロ[2,1-e]プリン、1H-ピラゾロ[4',3':3,4]ピリド[2,1-a]イソインドール、1H-ピリド[2',3':4,5]イミダゾ[2,1-a]イソインドール、2H,6H-ピリド[1',2':3,4]イミダゾ[5,1-a]イソインドール、1H-イソインドロ[2,1-a]ベンズイミダゾール、1H-ピリド[3',4':4,5]ピロロ[2,1-a]イソインドール、2H-ピリド[4',3':4,5]ピロロ[2,1-a]イソインドール、1H-イソインドロ[2,1-a]インドール、2H-イソインドロ[1,2-a]イソインドール、1H-シクロペンタ[4,5]ピリミド[2,1-a]イソインドール、2H,4H-ピラノ

〔4', 3': 4, 5〕〔1, 3〕オキサジノ〔2, 3-a〕イソインドール, 2H-イソインドロ〔2, 1-a〕〔3, 1〕ベンズオキサジン, 7H-イソインドロ〔1, 2-b〕〔1, 3〕ベンズオキサジン, 2H-ピリド〔2', 1': 3, 4〕ピラジノ〔2, 1-a〕イソインドール, ピリド〔2', 3': 4, 5〕ピリミド〔2, 1-a〕イソインドール, ピリド〔3', 2': 5, 6〕ピリミド〔2, 1-a〕イソインドール, 1H-ピリド〔1', 2': 3, 4〕ピリミド〔2, 1-a〕イソインドール, イソインドロ〔2, 1-a〕キナゾリン, イソインドロ〔2, 1-a〕キノキサリン, イソインドロ〔1, 2-a〕イソキノリン, イソインドロ〔2, 1-b〕イソキノリン, イソインドロ〔2, 1-a〕キノリン, 6H-オキサジノ〔3', 4': 3, 4〕〔1, 4〕ジアゼピノ〔2, 1-a〕イソインドール, アゼピノ〔2', 1': 3, 4〕ピラジノ〔2, 1-a〕イソインドール, 2H, 6H-ピリド〔2', 1': 3, 4〕〔1, 4〕ジアゼピノ〔2, 1-a〕イソインドール, 1H-イソインドロ〔1, 2-b〕〔1, 3, 4〕ベンゾトリアゼピン, 2H-イソインドロ〔2, 1-a〕〔1, 3, 4〕ベンゾトリアゼピン, イソインドロ〔2, 1-d〕〔1, 4〕ベンズオキサゼピン, 1H-イソインドロ〔2, 1-b〕〔2, 4〕ベンゾジアゼピン, 1H-イソインドロ〔2, 1-c〕〔2, 3〕ベンゾジアゼピン, 2H-イソインドロ〔1, 2-a〕〔2, 4〕ベンゾジアゼピン, 2H-イソインドロ〔2, 1-d〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピン, 5H-イソインドロ〔2, 1-b〕〔3〕ベンズアゼピン, 2H-イソインドロ〔1, 2-a〕〔2〕ベンズアゼピン, 2H-イソインドロ〔1, 2-b〕〔3〕ベンズアゼピン, 2H-イソインドロ〔2, 1-b〕〔2〕ベンズアゼピン, 2H-イソインドロ〔1, 2-b〕〔1, 3, 4〕ベンゾオキサジアゾシン, イソインドロ〔2, 1-b〕〔1, 2, 6〕ベンゾトリアゾシン, 5H-4, 8-メタノ-1H-〔1, 5〕ジアザシクロウンデシノ〔1, 11-a〕インドール等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

【0042】上記式

【化19】

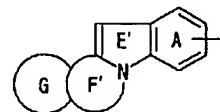


〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1H, 4H-ピロロ〔3', 2': 4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン, ピロロ〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 1H-フロ〔2', 3': 4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン, 1H, 4H-シクロペンタ〔4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-de〕キノキサリン, 1H, 4H-シクロペンタ〔4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン, ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロ

ロ〔1, 2, 3-de〕ベンズオキサジン, 〔1, 4〕オキサジノ〔2, 3, 4-jk〕カルバゾール, 1H, 3H-〔1, 3〕オキサジノ〔5, 4, 3-jk〕カルバゾール, ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-de〕〔1, 4〕ベンゾチアジン, 4H-ピロロ〔3, 2, 1-de〕フェナンスリジン, 4H, 5H-ピリド〔3, 2, 1-de〕フェナンスリジン, 1H, 4H-3a, 6a-ジアザフルオロアンテン, 1-オキサ-4, 6a-ジアザフルオロアンテン, 4-オキサ-2, 10b-ジアザフルオロアンテン, 1-チア-4, 6a-ジアザフルオロアンテン, 1H-ピラジノ〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 1H-インドロ〔3, 2, 1-de〕〔1, 5〕ナフチリジン, ベンゾ〔b〕ピラノ〔2, 3, 4-hi〕インドリジン, 1H, 3H-ベンゾ〔b〕ピラノ〔3, 4, 5-hi〕インドリジン, 1H, 4H-ピラノ〔2', 3': 4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン, 1H, 3H-ベンゾ〔b〕チオピラノ〔3, 4, 5-hi〕インドリジン, 1H-ピリド〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 4H-3-オキサ-11b-アザシクロヘプタ〔jk〕フルオレン, 2H-アゼピノ〔1', 2': 1, 2〕ピリミジノ〔4, 5-b〕インドール, 1H, 4H-シクロヘプタ〔4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-de〕キノキサリン, 5H-ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-ef〕〔1, 5〕ベンズオキサゼピン, 4H-ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-jk〕〔4, 1〕ベンゾチアゼピン, 5H-ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-ef〕〔1, 5〕ベンゾチアゼピン, 5H-ピリド〔4', 3': 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-ef〕〔1, 5〕ベンゾチアゼピン, 〔1, 2, 4〕トリアゼピノ〔6, 5, 4-jk〕カルバゾール, 〔1, 2, 4〕トリアゼピノ〔6, 7, 1-jk〕カルバゾール, 〔1, 2, 5〕トリアゼピノ〔3, 4, 5-jk〕カルバゾール, 5H-〔1, 4〕オキサゼピノ〔2, 3, 4-jk〕カルバゾール, 5H-〔1, 4〕チアゼピノ〔2, 3, 4-jk〕カルバゾール, 〔1, 4〕ジアゼピノ〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 〔1, 4〕ジアゼピノ〔6, 7, 1-jk〕カルバゾール, アゼピノ〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 1H-シクロオクタ〔4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-de〕キノキサリン, 1H-シクロオクタ〔4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

【0043】上記式

【化20】



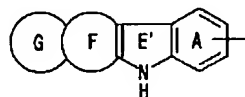
〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1H-インドロ〔1, 2-a〕ベンズイミダゾール, 1H-インドロ〔1, 2-b〕インダゾ

31

ル、ピロロ〔2', 1': 3, 4〕ピラジノ〔1, 2-a〕
 インドール, 1H, 5H-ピロロ〔1', 2': 4, 5〕
 ピラジノ〔1, 2-a〕インドール, 2H-ピリド
 〔2', 3': 3, 4〕ピロロ〔1, 2-a〕インドール,
 1H-ピロロ〔2', 3': 3, 4〕ピリド〔1, 2-a〕
 インドール, 1H-インドロ〔1, 2-a〕インドール,
 6H-イソインドロ〔2, 1-a〕インドール, 6H-イ
 ンドロ〔1, 2-c〕〔1, 3〕ベンズオキサジン, 1H
 -インドロ〔1, 2-b〕〔1, 2〕ベンゾチアジン, ピ
 リミド〔4', 5': 4, 5〕ピリミド〔1, 6-a〕イン
 ドール, ピラジノ〔2', 3': 3, 4〕ピリド〔1, 2-a〕
 インドール, 6H-ピリド〔1', 2': 3, 4〕ピリ
 ミド〔1, 6-a〕インドール, インドロ〔1, 2-b〕シ
 ノノリン, インドロ〔1, 2-a〕キナゾリン, インドロ
 〔1, 2-c〕キナゾリン, インドロ〔2, 1-b〕キナゾ
 リン, インドロ〔1, 2-a〕キノキサリン, インドロ
 〔1, 2-a〕〔1, 8〕ナフチリジン, インドロ〔1, 2
 -b〕-2, 6-ナフチリジン, インドロ〔1, 2-b〕
 〔2, 7〕ナフチリジン, インドロ〔1, 2-b〕-1, 7
 -ナフチリジン, インドロ〔1, 2-b〕イソキノリン,
 インドロ〔2, 1-a〕イソキノリン, インドロ〔1, 2
 -a〕キノリン, 2H, 6H-ピリド〔2', 1': 3,
 4〕〔1, 4〕ジアゼピノ〔1, 2-a〕インドール, 1
 H-インドロ〔2, 1-c〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピ
 ン, 2H-インドロ〔1, 2-d〕〔1, 4〕ベンゾジア
 ゼピン, 2H-インドロ〔2, 1-a〕〔2, 3〕ベンゾ
 ジアゼピン, 2H-インドロ〔2, 1-b〕〔1, 3〕ベ
 ンゾジアゼピン, 1H-インドロ〔1, 2-b〕〔2〕ベ
 ンズアゼピン, 2H-インドロ〔2, 1-a〕〔2〕ベンズ
 アゼピン, インドロ〔1, 2-e〕〔1, 5〕ベンゾジア
 ゾシン, インドロ〔2, 1-b〕〔3〕ベンズアゾシン等
 の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してで
 ける基が挙げられる。

【0044】上記式

【化21】



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基
 の具体例としては、1H-イミダゾ〔1', 2': 1,
 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 1H-イミダゾ
 〔1', 2': 1, 6〕ピリド〔4, 3-b〕インドール,
 1H-イミダゾ〔1', 5': 1, 2〕ピリド〔3, 4-a〕
 インドール, 1H-イミダゾ〔1', 5': 1, 6〕ピ
 リド〔4, 3-b〕インドール, 1H-ピリド〔2',
 1': 2, 3〕イミダゾ〔4, 5-b〕インドール, イミダ
 ゾ〔4, 5-a〕カルバゾール, イミダゾ〔4, 5-c〕カ
 ルバゾール, ピラゾロ〔3, 4-c〕カルバゾール, 2H

32

-ピラジノ〔1', 2': 1, 5〕ピロロ〔2, 3-b〕イ
 ンドール, 1H-ピロロ〔1', 2': 1, 2〕ピリミド
 〔4, 5-b〕インドール, 1H-インドリジノ〔6, 7
 -b〕インドール, 1H-インドリジノ〔8, 7-b〕イ
 ンドール, インドロ〔2, 3-b〕インドール, インドロ
 〔3, 2-b〕インドール, ピロロ〔2, 3-a〕カルバゾ
 ール, ピロロ〔2, 3-b〕カルバゾール, ピロロ〔2,
 3-c〕カルバゾール, ピロロ〔3, 2-a〕カルバゾ
 ール, ピロロ〔3, 2-b〕カルバゾール, ピロロ〔3, 2
 -c〕カルバゾール, ピロロ〔3, 4-a〕カルバゾ
 ール, ピロロ〔3, 4-b〕カルバゾール, ピロロ〔3, 4
 -c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3', 4': 4, 5〕
 フロ〔3, 2-b〕インドール, 1H-フロ〔3, 4-a〕
 カルバゾール, 1H-フロ〔3, 4-b〕カルバゾール,
 1H-フロ〔3, 4-c〕カルバゾール, 2H-フロ
 〔2, 3-a〕カルバゾール, 2H-フロ〔2, 3-c〕カ
 ルバゾール, 2H-フロ〔3, 2-a〕カルバゾール, 2
 H-フロ〔3, 2-c〕カルバゾール, 1H-ピリド
 〔3', 4': 4, 5〕チエノ〔2, 3-b〕インドール,
 チエノ〔3', 2': 5, 6〕チオピラノ〔4, 3-b〕イ
 ンドール, チエノ〔3', 4': 5, 6〕チオピラノ〔4,
 3-b〕インドール, 1H-〔1〕ベンゾチエノ〔2, 3
 -b〕インドール, 1H-〔1〕ベンゾチエノ〔3, 2-
 b〕インドール, 1H-チエノ〔3, 4-a〕カルバゾ
 ール, 2H-チエノ〔2, 3-b〕カルバゾール, 2H-チ
 エノ〔3, 2-a〕カルバゾール, 2H-チエノ〔3, 2
 -b〕カルバゾール, シクロペンタ〔4, 5〕ピロロ
 〔2, 3-f〕キノキサリン, シクロペンタ〔5, 6〕ピ
 リド〔2, 3-b〕インドール, ピリド〔2', 3': 3,
 4〕シクロペンタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド
 〔2', 3': 4, 5〕シクロペンタ〔1, 2-b〕インド
 ール, ピリド〔3', 4': 3, 4〕シクロペンタ〔1, 2
 -b〕インドール, ピリド〔3', 4': 4, 5〕シクロペ
 ンタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 4,
 5〕シクロペンタ〔1, 2-b〕インドール, 1H-シク
 ロペンタ〔5, 6〕ピラノ〔2, 3-b〕インドール, 1
 H-シクロペンタ〔5, 6〕チオピラノ〔4, 3-b〕イ
 ンドール, シクロペンタ〔a〕カルバゾール, シクロペ
 ンタ〔c〕カルバゾール, インデノ〔1, 2-b〕インド
 ール, インデノ〔2, 1-b〕インドール, 〔1, 2, 4〕
 トリアジノ〔4', 3': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕イ
 ンドール, 1, 3, 5-トリアジノ〔1', 2': 1, 1〕
 ピリド〔3, 4-b〕インドール, 1H-〔1, 4〕オキ
 サジノ〔4', 3': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インド
 ール, 1H-〔1, 4〕オキサジノ〔4', 3': 1, 6〕
 ピリド〔3, 4-b〕インドール, 4H-〔1, 3〕オキ
 サジノ〔3', 4': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インド
 ール, インドロ〔3, 2-b〕〔1, 4〕ベンズオキサジ
 ン, 1, 3-オキサジノ〔6, 5-b〕カルバゾール, 2
 H-ピリミド〔2', 1': 2, 3〕〔1, 3〕チアジノ

33

〔5,6-b〕インドール, 2H-〔1,3〕チアジノ〔3', 2': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, 4H-〔1,3〕チアジノ〔3', 4': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, インドロ〔2,3-b〕〔1,4〕ベンゾチアジン, インドロ〔3,2-b〕〔1,4〕ベンゾチアジン, インドロ〔3,2-c〕〔2,1〕ベンゾチアジン, 1,4-チアジノ〔2,3-a〕カルバゾール, 〔1,4〕チアジノ〔2,3-b〕カルバゾール, 〔1,4〕チアジノ〔2,3-c〕カルバゾール, 1,4-チアジノ〔3,2-b〕カルバゾール, 1,4-チアジノ〔3,2-c〕カルバゾール, 1H-インドロ〔2,3-g〕アテリジン, 1H-インドロ〔3,2-g〕アテリジン, ピラジノ〔1', 2': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, ピラジノ〔1', 2': 1,2〕ピリド〔4,3-b〕インドール, 1H-ピリド〔2', 3': 5,6〕ピラジノ〔2,3-b〕インドール, 1H-ピリド〔3', 2': 5,6〕ピラジノ〔2,3-b〕インドール, 1H-ピリド〔3', 4': 5,6〕ピラジノ〔2,3-b〕インドール, ピリド〔1', 2': 1,2〕ピリミド〔4,5-b〕インドール, ピリド〔1', 2': 1,2〕ピリミド〔5,4-b〕インドール, ピリド〔2', 1': 2,3〕ピリミド〔4,5-b〕インドール, ピリミド〔1', 2': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, ピリミド〔1', 2': 1,6〕ピリド〔3,4-b〕インドール, ピリミド〔5', 4': 5,6〕ピラノ〔2,3-b〕インドール, ピラジノ〔4', 5': 5,6〕チオピラノ〔4,5-b〕インドール, 1H-インドロ〔3,2-c〕シンノリン, 1H-インドロ〔2,3-b〕キノキサリン, 1H-ピラジノ〔2,3-a〕カルバゾール, 1H-ピラジノ〔2,3-b〕カルバゾール, 1H-ピラジノ〔2,3-c〕カルバゾール, 1H-ピラジノ〔3,4-c〕カルバゾール, 1H-ピラジノ〔4,5-b〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔4,5-a〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔4,5-c〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔5,4-a〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔5,4-b〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔5,4-c〕カルバゾール, 7H-1,4-ジオキシノ〔2', 3': 5,6〕〔1,2〕ジオキシノ〔3,4-b〕インドール, 6H-〔1,4〕ベンゾジオキシノ〔2,3-b〕インドール, 6H-〔1,4〕ベンゾジチイノ〔2,3-b〕インドール, 1H-インドロ〔2,3-b〕-1,5-ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-b〕〔1,6〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-b〕〔1,8〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-c〕-1,5-ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-c〕〔1,6〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-c〕〔1,7〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-c〕〔1,8〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔3,2-b〕-1,5-ナフチリジン, 1H-インドロ〔3,2-b〕〔1,7〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔3,2-b〕〔1,8〕

34

ナフチリジン, 1H-インドロ〔3,2-c〕〔1,8〕ナフチリジン, インドロ〔2,3-a〕キノリジン, インドロ〔2,3-b〕キノリジン, インドロ〔3,2-a〕キノリジン, インドロ〔3,2-b〕キノリジン, ピラノ〔4', 3': 5,6〕ピリド〔3,4-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 4,5〕ピラノ〔3,2-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 5,6〕ピラノ〔2,3-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 5,6〕ピラノ〔3,4-b〕インドール, 1H-インドロ〔2,3-c〕イソキノリン, 1H-インドロ〔3,2-c〕イソキノリン, 1H-インドロ〔2,3-c〕キノリン, 1H-インドロ〔3,2-c〕キノリン, 1H-ピリド〔2,3-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔2,3-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔2,3-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,2-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,2-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,2-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,4-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,4-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,4-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔4,3-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔4,3-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔4,3-c〕カルバゾール, 1H-キンドリン, 1H-キニンドリン, 1H-ピラノ〔3', 4': 5,6〕ピラノ〔4,3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔2,3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔3,2-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔3,4-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔4,3-b〕インドール, 〔2〕ベンゾピラノ〔4,3-b〕インドール, ピラノ〔2,3-a〕カルバゾール, ピラノ〔2,3-b〕カルバゾール, ピラノ〔2,3-c〕カルバゾール, ピラノ〔3,2-a〕カルバゾール, ピラノ〔3,2-c〕カルバゾール, ピラノ〔3,4-a〕カルバゾール, 1H-ホスフィノリノ〔4,3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔2,3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔3,2-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔3,4-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔4,3-b〕インドール, 〔2〕ベンゾチオピラノ〔4,3-b〕インドール, 1H-ベンゾ〔a〕カルバゾール, 1H-ベンゾ〔b〕カルバゾール, 1H-ベンゾ〔c〕カルバゾール, 〔1,6,2〕オキサチアゼピノ〔2', 3': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, 1H-アゼピノ〔1', 2': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, 1H-ピリド〔1', 2': 1,2〕アゼピノ〔4,5-b〕インドール, 2H-ピリド〔1', 2': 1,2〕アゼピノ〔3,4-b〕インドール, 1H-ピリド〔3', 2': 5,6〕オキセピノ〔3,2-b〕インドール, 1H-ピリド〔4', 3': 5,6〕オキセピノ〔3,2-b〕インドール, 2H-ピリド〔2', 3': 5,6〕オキセピノ〔2,3-b〕インドール, 2H-ピリド〔2', 3': 5,6〕オキセピノ〔3,2-b〕インドール, 2H-ピリド

〔3', 4': 5, 6〕オキセピノ〔3, 2-b〕インドール, ビリド〔2', 3': 4, 5〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ビリド〔3', 2': 3, 4〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ビリド〔3', 4': 4, 5〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ビリド〔3', 4': 5, 6〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, 2H-ピラノ〔3', 2': 2, 3〕アゼピノ〔4, 5-b〕インドール, 1H-インドロ〔3, 2-b〕〔1, 5〕ベンズオキサゼピン, 1H-インドロ〔3, 2-d〕〔1, 2〕ベンズオキサゼピン, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 5〕ベンゾチアゼピン, 〔1, 4〕ジアゼピノ〔2, 3-a〕カルバゾール, インドロ〔2, 3-b〕〔1, 5〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔2, 3-d〕〔1, 3〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-b〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-b〕〔1, 5〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-d〕〔1, 3〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-d〕〔2, 3〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔2, 3-a〕〔3〕ベンズアゼピン, インドロ〔2, 3-c〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔2, 3-d〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔2, 3-d〕〔2〕ベンズアゼピン, インドロ〔3, 2-b〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔3, 2-c〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔3, 2-d〕〔1〕ベンズアゼピン, 1H-インドロ〔2, 1-b〕〔3〕ベンズアゼピン, 1H-〔1〕ベンズオキセピノ〔5, 4-b〕インドール, 1H-〔2〕ベンズオキセピノ〔4, 3-b〕インドール, 1H-〔1〕ベンゾチエピノ〔4, 5-b〕インドール, 1H-〔1〕ベンゾチエピノ〔5, 4-b〕インドール, ベンゾ〔3, 4〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ベンゾ〔4, 5〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ベンゾ〔5, 6〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ベンゾ〔6, 7〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, シクロヘプタ〔b〕カルバゾール, 4H-〔1, 5〕オキサゾシノ〔5', 4': 1, 6〕ビリド〔3, 4-b〕インドール, アゾシノ〔1', 2': 1, 2〕ビリド〔3, 4-b〕インドール, 2, 6-メタノ-2H-アゼシノ〔4, 3-b〕インドール, 3, 7-メタノ-3H-アゼシノ〔5, 4-b〕インドール, ビリド〔1', 2': 1, 8〕アゾシノ〔5, 4-b〕インドール, ビリド〔4', 3': 6, 7〕オキサシノ〔2, 3-b〕インドール, ビリド〔4', 3': 6, 7〕オキサシノ〔4, 3-b〕インドール, 1, 5-メタノ-1H-アゼシノ〔3, 4-b〕インドール, 2, 6-メタノ-1H-アゼシノ〔5, 4-b〕インドール, 1H-ビリド〔3', 4': 5, 6〕シクロオクタ〔1, 2-b〕インドール, 1, 4-エタノオキサシノ〔3, 4-b〕インドール, ピラノ〔3', 4': 5, 6〕シクロオクタ〔1, 2-b〕インドール, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 2, 5, 6〕ベンゾテトラゾシン, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 6〕ベンゾジアゾシ

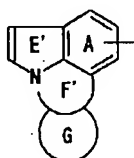
ン, 6, 13b-メタノ-13bH-アゼシノ〔5, 4-b〕インドール, オキサシノ〔3, 2-a〕カルバゾール, 1H-ベンゾ〔g〕シクロオクタ〔b〕インドール, 6, 3-〔イミノメタノ〕-2H-1, 4-チアゾニノ〔9, 8-b〕インドール, 1H, 3H-〔1, 4〕オキサゾニノ〔4', 3': 1, 2〕ビリド〔3, 4-b〕インドール, 2H-3, 6-エタノアゾニノ〔5, 4-b〕インドール, 2H-3, 7-メタノアザシクロウンデシノ〔5, 4-b〕インドール, 1H-6, 12b-エタノアゾニノ〔5, 4-b〕インドール, インドロ〔3, 2-e〕〔2〕ベンズアゾニン, 5, 9-メタノアザシクロウンデシノ〔5, 4-b〕インドール, 3, 6-エタノ-3H-アゼシノ〔5, 4-b〕インドール, 3, 7-メタノ-3H-アザシクロウンデシノ〔5, 4-b〕インドール, ピラノ〔4', 3': 8, 9〕アゼシノ〔5, 4-b〕インドール, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 7〕ベンゾジアゼシン, 1H-インドロ〔3, 2-e〕〔2〕ベンズアゼシン, ベンゾ〔e〕ピロロ〔3, 2-b〕インドール, ベンゾ〔e〕ピロロ〔3, 2-g〕インドール, ベンゾ〔e〕ピロロ〔3, 2, 1-hi〕インドール, ベンゾ〔e〕ピロロ〔3, 4-b〕インドール, ベンゾ〔g〕ピロロ〔3, 4-b〕インドール, 1H-ベンゾ〔f〕ピロロ〔1, 2-a〕インドール, 1H-ベンゾ〔g〕ピロロ〔1, 2-a〕インドール, 2H-ベンゾ〔e〕ピロロ〔1, 2-a〕インドール, 1H-ベンゾ〔f〕ピロロ〔2, 1-a〕イソインドール, 1H-ベンゾ〔g〕ピロロ〔2, 1-a〕イソインドール, 2H-ベンゾ〔e〕ピロロ〔2, 1-a〕イソインドール, イソインドロ〔6, 7, 1-cde〕インドール, スピロ〔シクロヘキサニ-1, 5'-〔5H〕ピロロ〔2, 1-a〕イソインドール〕, イソインドロ〔7, 1, 2-hij〕キノリン, 7, 11-メタノアゾシノ〔1, 2-a〕インドール, 7, 11-メタノアゾシノ〔2, 1-a〕イソインドール, ジベンズ〔cd, f〕インドール, ジベンズ〔cd, g〕インドール, ジベンズ〔d, f〕インドール, 1H-ジベンズ〔e, g〕インドール, 1H-ジベンズ〔e, g〕イソインドール, ナフト〔1, 2, 3-cd〕インドール, ナフト〔1, 8-e〕インドール, ナフト〔1, 8-fg〕インドール, ナフト〔3, 2, 1-cd〕インドール, 1H-ナフト〔1, 2-e〕インドール, 1H-ナフト〔1, 2-f〕インドール, 1H-ナフト〔1, 2-g〕インドール, 1H-ナフト〔2, 1-e〕インドール, 1H-ナフト〔2, 3-e〕インドール, 1H-ナフト〔1, 2-f〕イソインドール, 1H-ナフト〔2, 3-e〕イソインドール, スピロ〔1H-カルバゾール-1, 1'-シクロヘキサニ〕, スピロ〔2H-カルバゾール-2, 1'-シクロヘキサニ〕, シクロヘプタ〔4, 5〕ピロロ〔3, 2-f〕キノリン, シクロヘプタ〔4, 5〕ピロロ〔3, 2-h〕キノリン, アゼピノ〔4, 5-b〕ベンズ〔e〕イン

37

ル, 1H-アゼピノ〔1, 2-a〕ベンズ〔f〕インドール, 1H-アゼピノ〔2, 1-a〕ベンズ〔f〕イソインドール, ベンゾ〔e〕シクロヘプタ〔b〕インドール, ベンゾ〔g〕シクロヘプタ〔b〕インドール等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

【0045】上記式

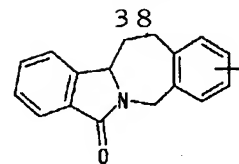
【化22】



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1H-ジピロ〔2, 3-b: 3', 2', 1'-hi〕インドール, スピロ〔シクロペンタン-1, 2' (1'H)-ピロ〔3, 2, 1-hi〕インドール〕, スピロ〔イミダゾリジン-4, 1' (2'H)-〔4H〕ピロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン〕, ピリド〔2, 3-b〕ピロ〔3, 2, 1-hi〕インドール, ピリド〔4, 3-b〕ピロ〔3, 2, 1-hi〕インドール, ベンゾ〔de〕ピロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン, 3H-ピロ〔3, 2, 1-de〕アクリジン, 1H-ピロ〔3, 2, 1-de〕フェナントリジン, スピロ〔シクロヘキサン-1, 6'-〔6H〕ピロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン〕, 4, 9-メタノピロ〔3, 2, 1-lm〕〔1〕ベンゾアゾシン, スピロ〔シクロヘプタン-1, 6'-〔6H〕ピロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン〕, 1H-ピラノ〔3, 4-d〕ピロ〔3, 2, 1-ijk〕〔1〕ベンズアゼピン, 3H-ベンゾ〔b〕ピロ〔3, 2, 1-ijk〕〔4, 1〕ベンズオキサゼピン, 7H-インドロ〔1, 7-ab〕〔4, 1〕ベンズオキサゼピン, ベンゾ〔b〕ピロ〔3, 2, 1-ijk〕〔1, 4〕ベンゾアゼピン, インドロ〔1, 7-ab〕〔1, 4〕ベンゾアゼピン, インドロ〔1, 7-ab〕〔1, 4〕ベンゾアゼピン, インドロ〔7, 1-ab〕〔3〕ベンズアゼピン, 1H-シクロヘプタ〔d〕〔3, 2, 1-ijk〕〔1〕ベンズアゼピン, スピロ〔アゼピノ〔3, 2, 1-hi〕インドール-7 (4H), 1'-シクロヘプタン〕, 4H-5, 11-メタノピロ〔3, 2, 1-no〕〔1〕ベンズアザシクロウンデシン, スピロ〔アゼピノ〔3, 2, 1-hi〕インドール-7 (4H), 1'-シクロオクタン〕等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基等が挙げられる。

【0046】このうち、さらに好ましくは、式

【化23】

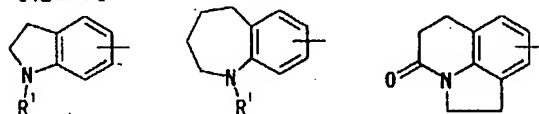


で表される基等である。

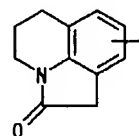
【0047】Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」として、好ましくは、例えば置換基を有していてもよい

10 式

【化24】



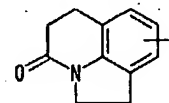
または



20

で表される基である。特に好ましくは、式

【化25】



で表される基である。

【0048】nは、好ましくは、1ないし6の整数である。さらに好ましくは2ないし6である。特に好ましくは2である。RおよびR'は、それぞれ水素原子、ハロゲン原子または置換基を有していてもよい炭化水素基を示し、nの繰返しにおいて異なってもよい。RおよびR'で示される「ハロゲン原子」としては、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等が挙げられ、なかでもフッ素が好ましい。RおよびR'で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」としては、R¹で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」と同様のものが挙げられる。RおよびR'としては水素原子またはフッ素が好ましい。RおよびR'としては水素原子がさらに好ましい。Yで示される「置換されていてもよいアミノ基」としては、例えば式

【化26】



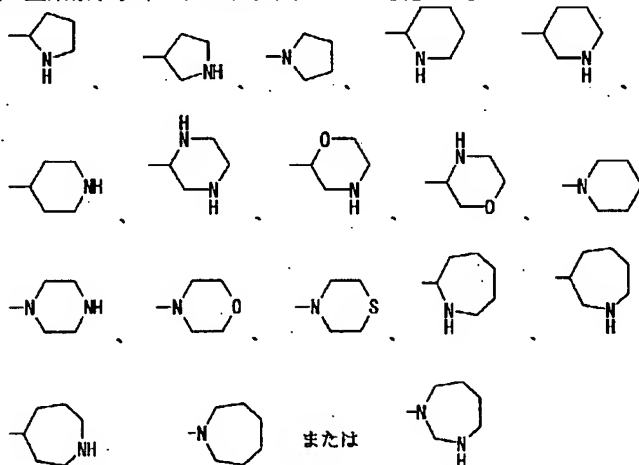
〔式中、R⁴ および R⁵ は、それぞれ水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基またはアシル基を示す。〕で表される基等が挙げられる。R⁴ または R⁵ で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」および「アシル基」としては、R¹ で示される「置換基を有

していてもよい炭化水素基」および「アシル基」と同様のものが挙げられる。

【0049】Yで示される「置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基」の「含窒素飽和複素環基」としては、炭素原子および1個の窒素原子以外に、窒素原子、*

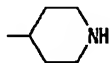
* 酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよい5ないし9員（好ましくは5ないし7員）含窒素飽和複素環基等が挙げられる。具体的には、式

【化27】



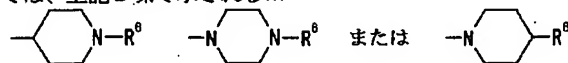
で表される基等が挙げられる。このうち、好ましくは6員環基である。さらに好ましくは

【化28】



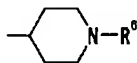
である。

【0050】該「置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基」の「置換基」としては、上記B環で示される※



〔式中、R⁶はR¹と同意義を示す。〕で表される基等である。さらに好ましくは、式

【化30】



〔式中、R⁶は上記と同意義を示す。〕で表される基等である。R⁶は、好ましくは、水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素基である。さらに好ましくは、ハロゲン原子（好ましくはフルオロ等）、C₁-6

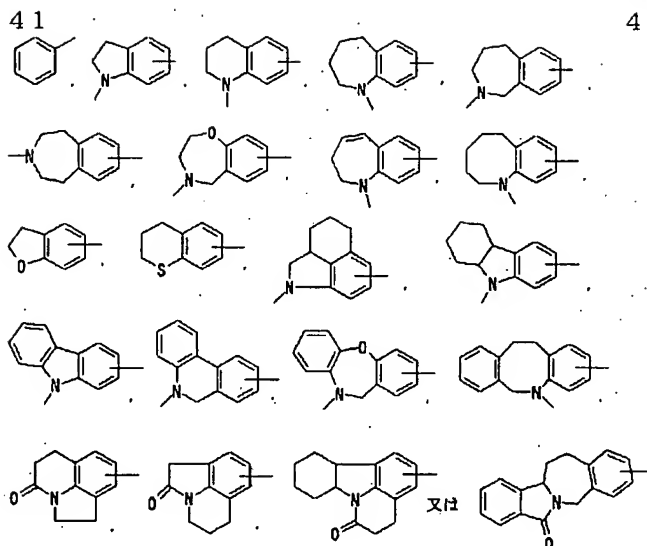
※「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」と同様のものが挙げられ、その置換基数は1ないし5個である。また、該「置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基」の「含窒素飽和複素環基」の窒素は、上記R¹で表される基と同様のものを有していてもよい。Yとして、好ましくは式

【化29】

★アルキル（好ましくはメチル等）、C₁-6アルコキシ（好ましくはメトキシ等）、シアノ、ニトロおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1ないし3個有していてもよいC₇-16アラルキル基（好ましくはベンジル）等である。

【0051】化合物（I）として、好ましくは、Arが式

【化31】



で表される基で、このうちArがフェニル基の場合、該フェニル基は(i)ハロゲン(フルオロ等)、(ii)C₁-6アルコキシ(メトキシ等)、(iii)アミノ、(iv)(モノまたはジ)C₁-6アルキルアミノ(メチルアミノ、エチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等)、(v)ピロリジノ、(vi)ピペリジノ、(vii)ピペラジノ、(viii)N-メチルピペラジノ、(ix)N-アセチルピペラジノ、(x)モルホリノ、(xi)ヘキサメチレンイミノ、(xii)イミダゾリルおよび(xiii)C₁-6アルキル(メチル等)でエステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよいC₁-6アルキル(プロピル等)から選ばれる置換基を有していてもよく、

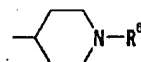
【0052】Arが縮合したフェニル基の場合、その複素環部分は①C₁-6アルキル(メチル、エチル、プロピル、n-ブチル等)、②ハロゲン(フルオロ、クロロ等)、C₁-6アルキル(メチル等)、C₁-6アルコキシ(メトキシ等)およびニトロから選ばれる置換基を有していてもよいC₇-16アラルキル(ベンジル、フェニルエチル等)、③C₁-6アルキル-カルボニル(アセチル、プロピオニル、イソブチリル、ヒバロイル等)、④C₇-16アラルキル-カルボニル(フェニルアセチル等)、⑤C₆-14アリール-カルボニル(ベンゾイル等)、⑥C₁-6アルキル-カルボニル-C₆-14アリール(メチルベンゾイル等)、⑦C₁-6アルコキシ-カルボニル-C₆-14アリール(メトキシベンゾイル等)および⑧ピリジルから選ばれる置換基を有していてもよく、nが2；RおよびR'がそれぞれ水素原子またはフッ素(より好ましくは水素原子)；すなわち、

【化32】



*が-CH₂CH₂-, -CHFCH₂-またはCF₂CH₂-；Yが式

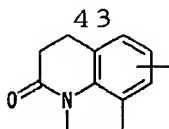
【化33】



(式中の記号は上記と同意義を示す。)で表される基で、R⁶が①水素原子、②シアノ、ヒドロキシ、(モノまたはジ)C₁-6アルキルアミノ(ジエチルアミノ等)、ピリジルおよび(C₁-6アルキル(エチル等)で)エステル化されていてもよいカルボキシから選ばれる置換基を有していてもよいC₁-6アルキル(メチル、エチル、イソプロピル等)、③ハロゲン(フルオロ、クロロ等)、C₁-6アルキル(メチル、t-ブチル等)、ハロゲンC₁-6アルキル(トリフルオロメチル等)、ヒドロキシ、C₁-6アルコキシ(メトキシ等)、ニトロ、アミノ、シアノ、カルバモイル、(C₁-6アルキル等で)エステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよいC₁-6アルコキシ(OC₂H₅CO₂H、OC₂H₅CO₂Et等)、C₁-6アルキルで置換されていてもよいカルバモイルまたはホルミルで置換されていてもよいアミノ(NHCHO、NHCONH₂、NHCONHMe等)およびC₁-3アルキレンジオキシ(メチレンジオキシ等)から選ばれる置換基を有していてもよいC₇-16アラルキル(ベンジル、α-メチルベンジル、フェニルエチル等)、④(C₁-6アルキル(エチル等)等で)エステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよいC₁-6アルキル(メチル、プロピル等)または⑤(モノまたはジ)C₁-6アルキルアミノ(ジメチルアミノ等)で置換されていてもよいC₁-6アルキル-カルボニル(アセチル等)である化合物等が挙げられる。

【0053】化合物(I)として、さらに好ましくは、Arが式

【化34】



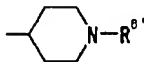
で表される基；nが2；RおよびR'がそれぞれ水素原子またはフッ素（より好ましくは水素原子）；すなわち、

【化35】



が-CH₂CH₂-, -CHFCH₂-またはCF₂CH₂-；Yが式

【化36】



〔式中、R^{6'} はハロゲン原子、C₁-3アルキル、C₁-3アルコキシ、シアノ、ニトロおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1または2個有しているもよいベンジルを示す。〕で表される基である化合物等が挙げられる。

【0054】特に好ましくは、8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン、8-[3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン、8-[3-[1-[(2-ヒドロキシフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン、8-[2-フルオロ-3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン、またはその塩等が挙げられるが、本発明の結晶が有効成分の安定性や有効性の面から最も好適である。

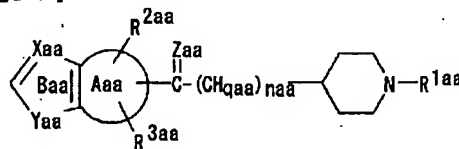
【0055】化合物(I)またはその塩は自体公知の方法またはそれに準じた方法によって製造することができる。具体的には、上記式中、(1)Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が縮合環を形成しない場合、特開平3-173867号(EP-A-0378207号)、特開昭64-79151号(EP-A-0296560号)記載の方法等、(2)Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が置換基を有していてもよい単環式複素環と縮合する場合、特開平5-140149号(E

44

P-A-0487071号)、特開平6-166676号(EP-A-0560235号)、特開平6-206875号(EP-A-0567090号)、特開平2-169569号(USP 4,895,841号)記載の方法等、(3)Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が置換基を有していてもよい2環式複素環と縮合する場合、あるいは2つの同一または異なった単環(但し、少なくとも一方の環が単環式複素環である)と縮合する場合、特開平7-206854号(EP-A-0607864号)記載の方法等、および(4)Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が置換基を有していてもよい3環式複素環と縮合する場合、特開平7-309835(EP-A-0655451号)記載の方法等に従って目的物を製造すればよい。

【0056】2)式

【化37】



〔式中、C=Zaaを含む側鎖、R^{2aa}あるいはR^{3aa}のうちひとつは、環Baaの*で示した炭素原子に結合し、環Aaaはベンゾ、チエノ、ピリド、ピラジノ、ピリミド、フラノ、セレノ、ピロロ、チアゾロあるいはイミダゾロを示し、R^{1aa}はフェニル、フェニル-C₁₋₆アルキル、シンナミルまたはヘテロアリールメチル(ここでヘテロアリール基としては、イミダゾロ、チアゾロ、チエノ、ピリドまたはイソオキサゾロを示す)を示し、フェニルおよびヘテロアリール基はC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシおよびハロゲンから選ばれる置換基を1~2個有していてもよい。R^{2aa}およびR^{3aa}は、それぞれ独立して、水素原子、C₁₋₆アルコキシ、1~3個のフッ素で置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、ベンジルオキシ、ヒドロキシ、フェニル、ベンジル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、COOR^{4aa}、CONHR^{4aa}、NR^{4aa}R^{5aa}、NR^{4aa}COR^{5aa}またはSO_paaCH₂Ph(ここでpaaは0, 1または2を示す)を示すか、R^{2aa}とR^{3aa}は隣接する炭素原子と共に5ないし6員環(環の構成原子は、炭素、窒素、酸素)、例えばメチレンジオキシ、エチレンジオキシあるいはラクタム環を形成してもよい。また、R^{4aa}およびR^{5aa}はそれぞれ独立して、水素原子またはC₁₋₆アルキル基を示すか、NR^{4aa}R^{5aa}のR^{4aa}およびR^{5aa}は隣接する窒素原子と共に窒素原子を少なくとも1個含む4ないし8員環(環の他の構成原子は炭素、酸素または窒素である。)を形成してもよい。またNR^{4aa}COR^{5aa}のR^{4aa}およびR^{5aa}は隣接する窒素原子および炭素原子と共に4ないし8員ラクタム

20

30

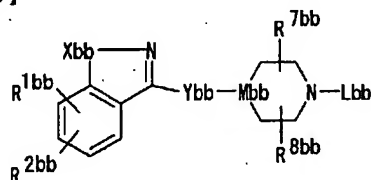
40

50

環を形成してもよい。Xaaは窒素あるいはCHを、Yaaは酸素、イオウあるいはNR^{6aa}を示す。R^{6aa}は水素原子、C₁-6アルキル、CO-C₁-6アルキルあるいはSO₂-フェニル（ここで、フェニル基はC₁-4アルキルから独立して選ばれる1ないし5個の置換基を有していてもよい）を示す。naaは1ないし4の整数を、それぞれのqaaは独立して1ないし2を、Zaaは酸素あるいはイオウを示す。）で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-(2-メチル-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-3-[1-(フェニルメチル)-4-ビペリジニル]-1-プロパノン、1-(6-メチルベンゾ[b]チエ-2-イル)-3-[1-(フェニルメチル)-4-ビペリジニル]-1-プロパノン、1-(6-メチルインドール-2-イル)-3-[1-(フェニルメチル)-4-ビペリジニル]-1-プロパノン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、WO 93/07140記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0057】3) 式

【化38】

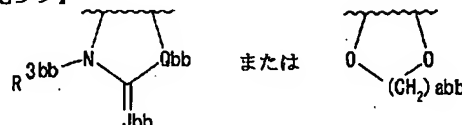


〔式中、R^{1bb} および R^{2bb} はそれぞれ、水素原子、C₁-6アルコキシ、ベンジルオキシ、フェノキシ、ヒドロキシ、フェニル、ベンジル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、式: COR^{5bb}、-COOR^{5bb}、-CONHR^{5bb}、-NR^{5bb} R^{6bb} または NR^{5bb} COR^{6bb} (式中、R^{5bb} および R^{6bb} はそれぞれ i) 水素原子、ii) C₁-6アルキル、iii) ハロゲン、C₁-4アルキル、トリフルオロメチル、C₁-4アルコキシ、シアノ、ニトロおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1または2個それぞれ有していてもよいフェニルまたはベンジル; または NR^{5bb} R^{6bb} の R^{5bb} と R^{6bb} とは一緒になって4ないし8員含窒素環を形成、NR^{5bb} COR^{6bb} の R^{5bb} と R^{6bb} とは一緒になって4ないし8員ラクタム環を形成する) で表される基、1ないし3個のフッ素で置換されていてもよい C₁-6アルキル、式: SO_{pbb} CH₂-フェニル または SO_{pbb} C₁-6アルキル (式中、pbbは0、1または2を示す) で表される基、ビリジルメチルオキシ、チエニルメチルオキシ、2-オキサゾリル、2-チアゾリルまたはベンゼンスルホンアミド (該フェノキシ、ベンジルオキシ、フェニル、ベンジル、ベンゼンスルホンアミド、ビリジルメチルオキシ、チエニルメチルオキシ、2-オキサゾリル、2-チアゾリルは、ハロゲン、C₁-6アルキル、

トリフルオロメチル、C₁-6アルコキシ、シアノ、ニトロおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1または2個を有していてもよい); または R^{1bb} および R^{2bb} は隣接する炭素原子に結合する場合および Xbbが酸素、硫黄または NR^{4bb} (R^{4bb} は、水素または C₁-4アルキルである) である場合、これらが結合する炭素原子と一緒に式

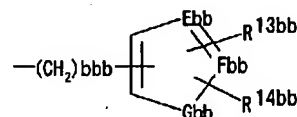
【0058】

【化39】



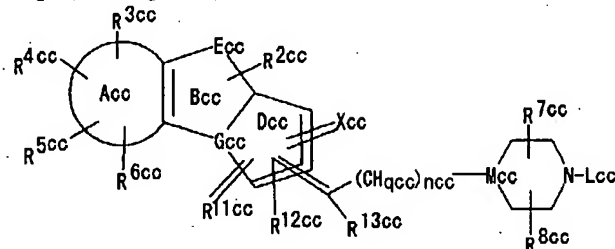
〔式中、Jbbは酸素、硫黄または NR^{4bb}、abbは1または2、R^{3bb} は水素または C₁-6アルキル Qbbは酸素、硫黄、NH、CHCH₃、C(CH₃)₂、-CH=CH- または (CH₂)_{1bb}、および 1bbは1ないし3の整数を示す。〕で表される基を形成; Xbbは酸素、硫黄、-CH=CH-、-CH=N-、-NH=CH-、-N=N- または NR^{4bb} (R^{4bb} は上記と同意義); Ybbは -(CH₂)_{mbb}、-CH=CH(CH₂)_{nbb}、-NR^{4bb} (CH₂)_{mbb} または -O(CH₂)_{mbb} (R^{4bb} は上記と同意義、mbbは0ないし3の整数、mbbは1ないし3の整数; Mbbは -CH- または窒素; Lbbは i) ハロゲン、C₁-6アルキル、C₁-6アルコキシ、C₁-6アルコキシ-カルボニルまたは C₁-6アルキル-カルボニルから選ばれる置換基を1ないし3個それぞれ有していてもよいフェニルまたはフェニル-C₁-6アルキル、ii) シンナミル、iii) ビリジルメチル、または i v) 式:

【化40】



〔式中、bbbは1ないし4の整数、R^{13bb} および R^{14bb} はそれぞれ水素、C₁-4アルキル、ハロゲンまたはフェニル、EbbおよびFbbはそれぞれ -CH- または窒素、Gbbは酸素、硫黄または NR^{4bb} (R^{4bb} は上記と同意義) を示す。但し、EbbおよびFbbが両者とも窒素の場合、R^{13bb} および R^{14bb} の一方は存在せず。〕で表される基; R^{7bb} および R^{8bb} はそれぞれ水素、C₁-6アルキル、C₁-6アルコキシ-カルボニル、C₁-6アルキル-カルボニルまたは C₁-6アルコキシを示す。但し、該C₁-6アルコキシは窒素に隣接する炭素原子には結合しない。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、3-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ビペリジニル]

エチル]-5, 6, 8-トリヒドロ-7H-イソキサゾ
ロ[4, 5-g]キノリン-7-オン, 6, 8-ジヒド
ロ-3-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ビペリ
ジニル]エチル]-7H-ピロロ[5, 4-g]-1,
2-ベンズイソキサゾール-7-オン, 5, 7-ジヒド
ロ-3-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ビペリ
ル]エチル]-6H-ピロロ[5, 4-f]-1, 2- *



〔式中、環Accはベンゾ、チエノ、ピリド、ピラジノ、
ピリミド、フラノ、セレンロまたはピロロ；R^{2cc}は
水素、C₁-4アルキル、ベンジル、フルオロまたはシ
アノ；R^{3cc}、R^{4cc}、R^{5cc}およびR^{6cc}は
それぞれ、水素、C₁-6アルコキシ、ベンジロキシ
シ、フェノキシ、ヒドロキシ、フェニル、ベンジル、ハ
ロゲン、ニトロ、シアノ、-COOR^{9cc}、-CON
HR^{9cc}、-NR^{9cc}、R^{10cc}、-NR^{9cc}、C
OR^{10cc}、または1ないし3個のフッ素原子で置換
されていてもよいC₁-6アルキル；SO_pcc、CH
2-フェニル（pccは0、1または2）、ピリジルメチ
ルオキシまたはチエニルメチルオキシ（該フェノキシ、
ベンジロキシ、フェニル、ピリジルメチルオキシおよ
びチエニルメチルオキシは、ハロゲン、C₁-4アルキ
ル、トリフルオロメチル、C₁-4アルコキシ、シア
ノ、ニトロおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1ま
たは2個有していてもよい）；またはR^{3cc}、R
4cc、R^{5cc}およびR^{6cc}の2つは、隣接する炭
素原子と一緒に、該隣接炭素原子と共に環の各原
子が炭素、窒素または酸素である飽和5または6員環
（例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシまたは
ラクタム環）を形成；R^{9cc}およびR^{10cc}はそれ
ぞれ水素またはC₁-6アルキル、またはNR^{9cc}、R
10ccのR^{9cc}およびR^{10cc}は一緒になって環
の1つの原子が窒素であり、他が炭素である4ないし8
員環状アミノ基を形成、またはNR^{9cc}、COR
10ccのR^{9cc}およびR^{10cc}は、一緒になって
4ないし8員環状ラクタム環を形成；

【0060】Gccは炭素または窒素；Eccは炭素、窒
素、酸素、硫黄、スルホキシドまたはスルホン；

【化42】

は単結合または二重結合；環Dccの1-、2-または3
-位のいずれかにある炭素がカルボニル基に隣接してい
る場合、適宜窒素で置換されていてもよい（該炭素は環※50

*ベンズイソキサゾール-6-オン等が挙げられる。上記
化合物またはその塩は、特表平6-500794号公報
（WO 92/17475）記載の方法またはそれに準
じた方法により製造される。

【0059】4）式

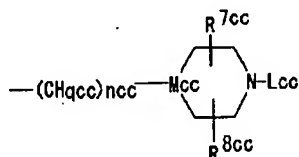
【化41】

※Dccの1-、2-または3-位にあるため環はラクタム
環となる）；XccはO、S、NOR^{1cc}、水素または
C₁-6アルキル（但し、Xccが結合している環Dccの
原子が炭素であり、XccがO、S、NOR^{1cc}である
20 ときのみ、Xccは環Dccに二重結合する）；R^{1cc}は
水素またはC₁-6アルキル；qccは1または2；環D
ccがラクタム環の場合、nccは1ないし3の整数、環D
ccがラクタム環ではない場合、nccは0または1ないし
3の整数；Mccは炭素または窒素；Lccはフェニル、フ
ェニル-C₁-6アルキル、シンナミルまたはピリジル
メチル（該フェニルおよびフェニル-C₁-6アルキル
は、C₁-6アルキル、C₁-6アルコキシ、C₁-6
アルコキシ-カルボニル、C₁-6アルキル-カルボ
ニルおよびハロゲンから選ばれる置換基を1ないし3個有
していてもよい）；R^{11cc}は水素、ハロゲン、ヒド
ロキシ、C₁-4アルキル、C₁-4アルコキシまたは
30 酸素；R^{12cc}およびR^{13cc}はそれぞれ、水素、
フルオロ、ヒドロキシ、アセトキシ、o-メシレート、
o-トシレート、C₁-4アルキルまたはC₁-4アル
コキシ；またはR^{12cc}およびR^{13cc}の両者が炭
素原子に結合している場合、それらが結合している原子
と一緒に、環の各原子が炭素または酸素である3ない
し5員環を形成；R^{7cc}およびR^{8cc}はそれぞ
れ、水素、C₁-6アルキルまたはC₁-6アルコキシ
（該C₁-6アルコキシは、窒素、C₁-6アルコキシ
-カルボニルおよびC₁-6アルキル-カルボニルに隣
接している炭素とは結合しない）；またはR^{8cc}およ
びR^{12cc}はそれらが結合している原子と一緒にとな
って4ないし7員飽和炭素環を形成する（上記炭素原子の
1つは、酸素、窒素または硫黄で置換されていてもよ
い）。

【0061】但し、（a）Eccが炭素、窒素、酸素、硫
黄、スルホキシドまたはスルホンの場合、Gccは炭素で
あり；（b）Gccが窒素の場合、Eccは炭素または窒素
であり；（c）EccとGccの両者が窒素の場合、Gcc

が炭素であり、Eccが酸素、硫黄、スルホキシドまたはスルホンの場合、R^{2cc}はなく；(d) 環Dccの1-、2-および3-位の原子の各々は1つをこえた二重結合で結合することはない；(e) R^{11cc}が酸素の場合、環Dccに二重結合し、R^{11cc}が酸素以外の場合、環Dccに一重結合し；(f) XccとR^{11cc}の両者が酸素で、かつ各々環Dccの1-および3-位の炭素に結合している、または各々環Dccの3-および1-位の炭素に結合している場合、環Dccの2-位の炭素は窒素で置換されており；(g)

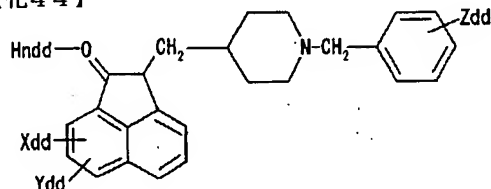
【化43】



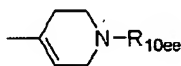
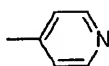
を含有する炭化水素基が結合している位置に隣接する位置でXccが環Dccに結合する。) で表される化合物またはその塩。具体例としては、2,3-ジヒドロ-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチレン]-1H-ピロロ[1,2-a]インドール-1-オン、1,2,3,4-テトラヒドロ-4-メチル-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチレン]-シクロペンタ[b]インドール-3-オン、2,3-ジヒドロ-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチル]-1H-ピロロ[1,2-a]ベンズイミダゾール-1-オン、1,2,3,4-テトラヒドロ-6-メチル-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]エチル]-ピロロ[3,4-b]インドール-3-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平4-234845号公報(E P-A-441517)記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0062】5)式

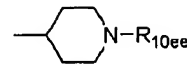
【化44】



40



または

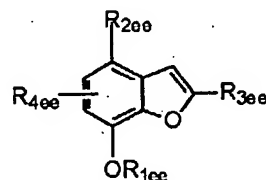


(ここで、R_{10ee}は水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、CONHR_{5ee}、CONR_{6ee}、R_{7ee}、アシル、アシルオキシ低級アルキルまたはアシルオキシアリール低級アルキルである)；R_{4ee}は水素、ハロゲン、低級アルキルまたは低級アルコキシ；※50

*〔式中、Xddは水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシまたはニトロ；Yddは水素または低級アルコキシ；またはXddとYddはいっしょに結合して基-OC₂H₅-を形成(この場合にはベンゼン環部分のXddとYddの各位置は互いに隣接していなければならない)；Zddは水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ、ハロゲンまたはニトロ；nddは0または1である。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては2-[(N-ベンジルピペリジン-4-イル)メチル]-2a, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1(2H)-アセナフチレン-1-オン、2-[[N-(3-フルオロベンジル)ピペリジン-4-イル]メチル]-2a, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1(2H)-アセナフチレン-1-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平6-116237号公報(EP-A-517221, USP 5, 106, 856)記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0063】6)式

【化45】



〔式中、R_{1ee}は水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、CONHR_{11ee}またはCONR_{6ee}、R_{7ee}；R_{2ee}は水素、シアノ、CH₂NR_{8ee}、R_{9ee}、CONHR_{5ee}またはCONR_{6ee}、R_{7ee}；R_{3ee}は

【化46】

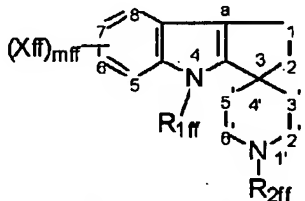
※R_{5ee}は水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキル；R_{6ee}は低級アルキルまたはアリール低級アルキル；R_{7ee}は低級アルキルまたはアリール低級アルキル；R_{8ee}は水素、低級アルキル、アリール低級アルキルまたはアシル；R_{9ee}は水素、低級アルキルま

51

たはアリール低級アルキル; R_{1ee} は低級アルキル、アリールまたはアリール低級アルキルである。但し、 R_{1ee} が水素または低級アルキルである場合、 R_{2ee} は水素ではない。) で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-メチル-4-(4-シアノ-7-メトキシ-2-ベンゾフラニル) ピペリジン、1-メチル-4-(4-N, N-ジエチルアミド-7-メトキシ-2-ベンゾフラニル) ピペリジン、1-メチル-4-(4-N, N-ジエチルアミノメチル-7-メトキシ-2-ベンゾフラニル) ピペリジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平7-109275号公報記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

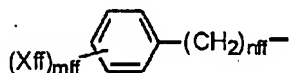
【0064】7) 式

【化47】



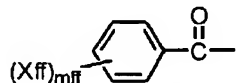
(式中、Xffは水素、ハロゲン、低級アルコキシ、低級アルキル、ヒドロキシまたはトリフルオロメチル; mffは1または2; R_{1ff} は水素または低級アルキル; R_{2ff} は水素、式

【化48】



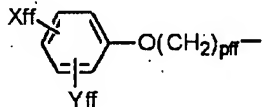
(式中、nffは1または2、Xffおよびmffは上記と同意義を示す) で表される基、式

【化49】



(式中、Xffとmffは上記と同意義を示す) で表される基、または式

【化50】



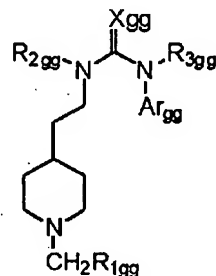
(式中、Xffは上記と同意義、Yffは水素または式: COR_{4ff} (式中、 R_{4ff} は水素または低級アルキルを示す)、pffは2または3を示す) である。) で表される化合物またはその塩。具体的には、1, 4-ジヒドロ-7-メトキシ-4-メチル-1'-フェニルメチルスピロ [シクロペンタ [b] インドール-3 (2H), 4'-ビペリジン]、1, 4-ジヒドロ-4-メチル-1'- (4-メトキシフェニル) メチルスピロ [シクロ

52

ペンタ [b] インドール-3 (2H), 4'-ビペリジン] 等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、WO 97/37992記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0065】8) 式

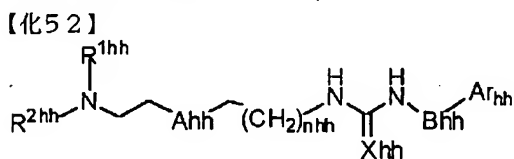
【化51】



(式中、 R_{1gg} はC5-7シクロアルキル基、フェニル基、またはC1-4アルキル基、C1-4アルコキシ基、ニトロ基若しくはハロゲン原子で置換されたフェニル基; R_{2gg} および R_{3gg} は、互いに独立して水素原子またはC1-4アルキル基; Xggはイオウ原子、酸素原子、CH-NO₂基またはN-R_{5gg}基 (ここで R_{5gg} は水素原子、ヒドロキシル基、C1-4アルコキシ基、C1-4アルキル基、シアノ基またはC1-4アルキルスルホニル基; Arggは、ハロゲン原子、C1-4アルキル基、C1-4アルコキシ基、C1-4アシル基、シアノ基、ニトロ基、トリフルオロメチル基およびトリフルオロメトキシ基から選ばれる置換基を1若しくは2以上それぞれ有しているもよいピリジル基またはフェニル基を意味する。) で表される化合物またはその塩。具体例としては、N-フェニル-N'-[2-(1-ベンジル-4-ビペリジル) エチル]-1, 1-ジアミノ-2-ニトロエチレン、1-(2-ビペリジル)-3-[2-(1-ベンジル-4-ビペリジル) エチル] チオ尿素、1-フェニル-2-ヒドロキシ-3-[2-(1-ベンジル-4-ビペリジル) エチル] グアニジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-148228号公報 (EP-A-516520) に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0066】9) 式

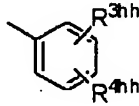
【化52】



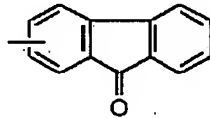
(式中、 R_{1hh} はC1-4アルキル基、 R_{2hh} はC5-7シクロアルキル基、C5-7シクロアルキル-メチル基、ベンジル基、またはC1-4アルキル基、C1-4アルコキシ基、ハロゲン原子若しくはニトロ基

53

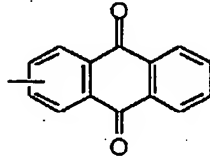
を有するベンジル基; Ahhは酸素原子またはメチレン基; Bhhは直接結合、メチレン基またはカルボニル基; Arhhはピリジル基、下式のフェニル基、
【化53】



(ここで、R3hhとR4hhは互いに独立して、水素、ハロゲン原子、ニトロ基、C1-4アルキル基、C1-4アルコキシ基、フェニル基またはトリフルオロメトキシ基を意味する)、下式のオキシフルオレニル基、
【化54】



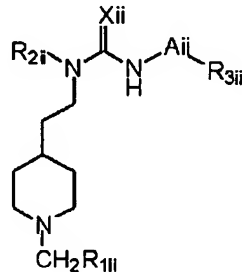
下式のジオキサアントラセニル基、
【化55】



またはナフチル基を、nhhは1または2を、Xhhは酸素原子またはイオウ原子を意味する。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-[2-(2-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)エトキシ)エチル]-3-(3-ニトロベンゾイル)チオ尿素、1-[2-(2-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)エトキシ)エチル]-3-(9-オキソ-2-フルオレノイル)チオ尿素等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-194359号公報(EP-A-526313)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0067】10)式

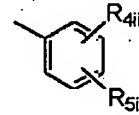
【化56】



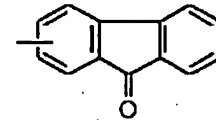
【式中、R1iiはC5-7シクロアルキル基、フェニル基、またはC1-4アルキル基、C1-4アルコキシ

54

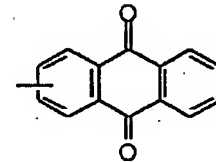
ル基若しくはハロゲン原子で置換されたフェニル基; R2iiは水素原子またはC1-4アルキル基; Xiiは酸素原子またはイオウ原子; Aiiはメチレン基、カルボニル基またはスルホニル基; R3iiは②式
【化57】



(ここで、R4iiとR5iiは互いに独立して、水素、ハロゲン原子、ニトロ基、C1-4アルキル基、C1-4アルコキシ基、C1-4アシル基、ベンゾイル基、C1-4アルキルスルホニル基またはトリフルオロメトキシ基を表すか、またはR4iiとR5iiが一緒になってメチレンジオキシ基を形成)で表される基、
②式
【化58】



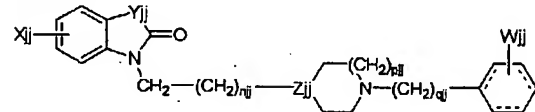
で表される基または③式
【化59】



で表される基; 但し、Xiiが酸素原子を表すときは、Aiiはメチレン基以外の基を表す。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-(3-ニトロベンゾイル)-3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]チオ尿素、1-(9,10-ジオキソ-2-アントラセノイル)-3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]チオ尿素等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平6-507387号公報(WO 92/14710)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

40 【0068】11)式

【化60】



【式中、nijは1、2または3であり; pijは1または2であり; qijは1または2であり; Xijは独立して水素、低級アルキル、アリール、アリールオキシ、CN、低級アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、アルキルスルホンアミド、NHCOR

55

jj (ここで、R_{jj}は低級アルキルまたはアリールである)、NR_{1jj}R_{2jj} (ここで、R_{1jj}およびR_{2jj}は独立して水素または低級アルキルであるか、一緒になって環を形成する)、CO₂R_{jj} (ここで、R_{jj}は低級アルキルである)、または場合によっては、さらに低級アルキルにより置換されたシクロアルキル、シクロアルケニル若しくはビスシクロアルキルから選択される1個以上の置換基であり；Y_{jj}はCOまたはCR_{3jj}R_{4jj} (ここで、R_{3jj}およびR_{4jj}は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシであるか、または一緒になって環状アセタールを形成する)であり；Z_{jj}はNまたはCHであり；

【化6.1】



は場合によっては置換されたフェニルまたはシクロヘキシル基である (ここで、W_{jj}は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシまたはハロゲンから選択される1個以上の置換基である) で表される化合物 (但し、n_{jj}=1、p_{jj}=1、q_{jj}=1、X_{jj}=H、Y_{jj}=CO、Z_{jj}=Nかつ

【化6.2】



が未置換フェニルである化合物、およびn_{jj}=2、p_{jj}=1、q_{jj}=1、X_{jj}=H、Y_{jj}=CO、Z_{jj}=Nかつ

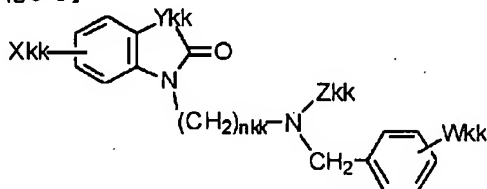
【化6.3】



が4-クロロフェニルである化合物を除く)、その立体異性体、光学異性体、ラセミ体またはそれらの塩。具体例としては、5-シクロヘキシル-1, 3-ジヒドロ-1-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]エチル]-2H-インドール-2-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平7-502272号公報 (WO 93/12085) に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0069】12) 式

【化6.4】



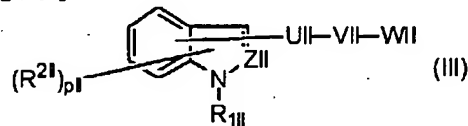
【式中、n_{kk}は3、4、5、6または7；X_{kk}は独立して水素、低級アルキル、アリール、低級アルコキシ、ハ

56

ロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、-NHCO R_{kk} (ここで、R_{kk}は低級アルキルまたはアリールである)、-NR_{1kk}R_{2kk} (ここで、R_{1kk}およびR_{2kk}は独立して水素または低級アルキルであるか、または一緒になって環を形成する)、または場合によっては、さらに低級アルキルにより置換されたシクロアルキル、シクロアルケニル若しくはビスシクロアルキルから選択される1個以上の置換基；Y_{kk}はCOまたはCR_{3kk}R_{4kk} (ここで、R_{3kk}およびR_{4kk}は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシであるか、または一緒になって環状アセタールを形成する)；Z_{kk}は低級アルキル；そして、W_{kk}は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシまたはハロゲンから選択される1個以上の置換基である。) で表される化合物、その立体異性体、光学異性体、ラセミ体またはそれらの塩。具体例として、5-シクロヘキシル-1, 3-ジヒドロ-1-[5-(N-エチル-N-フェニルメチルアミノ)ペンチル]-2H-インドール-2-オン、5-シクロヘキシル-1-[5-(N-エチル-N-フェニルメチルアミノ)ペンチル]-1H-インドール-2, 3-ジオン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平8-511515号公報 (WO 94/29272) に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0070】13) 式

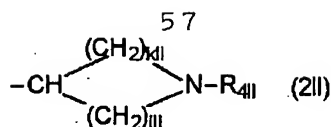
【化6.5】



【式中、R₁₁₁およびR₂₁₁は、それぞれ水素原子、下記置換基群A11より選択された基、または下記置換基群A11より選択された1ないし3個の置換基 (同一または異なって) をそれぞれ有していてもよいアリール基、アラルキル基、アラルキルオキシカルボニル基、アリールアミノ基、アリールアミノアルキル基、複素環基、複素環アルキル基若しくは複素環アミノアルキル基；p₁₁は1ないし3の整数を示す。；U₁₁は式：-CO- または -CH(OR₃₁₁)- で表される基 (式中、R₃₁₁は水素原子または水酸基の保護基を示す)；V₁₁は式：-(CH=CH)m₁₁-(CH₂)n₁₁- で表される基 (式中、m₁₁は0ないし2、n₁₁は0ないし7の整数を示す。但し、m₁₁およびn₁₁が同時に0であることはない)；W₁₁は環内窒素原子上にV₁₁と結合点を有する含窒素複素環基、

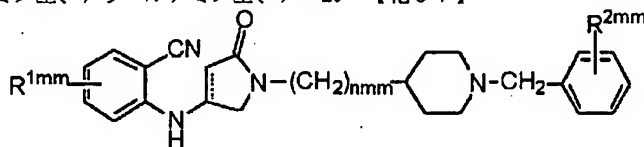
【0071】式

【化6.6】



で表される基(式中、 $k11$ および $l11$ は同一または異なつて1ないし4、 R_{411} は後記の R_{511} および R_{611} と同意義を有する)；上記一般式(211)において、環アルキレン基が5または6員環を形成するとき、該5または6員環中のエチレン基と1または2個のベンゼン環が縮合してなる基、または式： $\text{---NR}_{511}\text{R}_{611}$ で表される基(式中、 R_{511} および R_{611} はそれぞれ、水素原子、下記置換基群A11より選択される基、または下記置換基群A11より選択された1ないし3個の置換基(同一または異なつて)をそれぞれ有していてもよいアリール基、アリールカルボニル基、アラルキル基、複素環基若しくは複素環アルキル基を示す。)を示す。

置換基群A11：低級アルキル基、シクロアルキル基、アリール基、複素環基、アラルキル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキルアミノ基、アリールアミノ基、ア*20



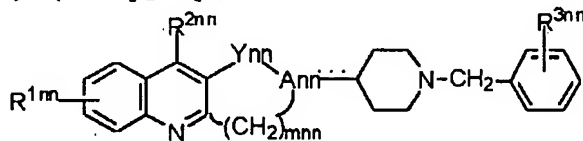
〔式中、 R^{1mm} は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基またはアルキルチオ基； R^{2mm} は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基またはアルコキシ基； nmm は0~7の整数；破線は二重結合が存在してもよいことを示す。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、 $N\text{---}[1\text{---}[4\text{---}(1\text{---ベンジルピペリジル})\text{エチル}]\text{---}2\text{---オキソ}\text{---}3\text{---ピロリン}\text{---}4\text{---イル}]\text{---}2\text{---アミツベンゾニトリル}$ 、 $N\text{---}[1\text{---}[4\text{---}*$

*ミノ低級アルキル基、低級アルキルアミノアルキル基、低級アルキルアミノアルキル基、ニトロ基、シアノ基、スルフォニル基、低級アルキルスルフォニル基、ハロゲンアルキルスルフォニル基、低級アルカノイル基、アリールカルボニル基、アリールアルカノイル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン低級アルキル基、 $N\text{---}$ 低級アルキニル、 $N\text{---}$ シアノアミノ基、 $N\text{---}$ 低級アルキニルおよび $N\text{---}$ メチルアミノメチル基。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-メチル-3-[3-(1-ベンジル-4-ビペリジル)プロピオニル]インドール、1-メチル-3-[3-[1-(3-フルオロベンジル)-4-ビペリジル]プロピオニル]-5-フルオロインドール、1-メチル-3-[3-[1-(2-クロロベンジル)-4-ビペリジル]プロピオニル]インダゾール等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平6-41070号公報(EP-A-562832)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

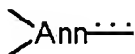
【0072】14)式
【化67】

※(1-ベンジルピペリジル)プロピル]-2-オキソ-3-ピロリン-4-イル]-2-アミノベンゾニトリル等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-9188号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0073】15)式
【化68】



〔式中、
【化69】



は、 $>\text{N---}(\text{CH}_2)_{nnn}\text{---}$ 、 $>\text{C=}$ 、 $>\text{C=CH}(\text{CH}_2)_{nnn}\text{---}$ または $>\text{CH}(\text{CH}_2)_{nnn}\text{---}$ (ここで nnn は0~7の整数を示す)； Ynn は $>\text{C=O}$ または $>\text{CHOH}$ ； R^{1nn} は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基またはアルキルチオ基； R^{2nn} は水素原子、ハロゲン原子、水酸基、アルキル基、アルコキシ基、置換基を有してもよいフェニル基、フェノキシ基、アルカノイルオキシ基または置換基を有してもよい★50

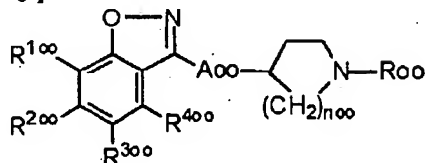
★アミノ基； R^{3nn} は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基またはアルコキシ基； mnn は1~3の整数を示す。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、9-アミノ-2-[4-(1-ベンジルピペリジル)エチル]-2,3-ジヒドロピロ[3,4-b]キノリン-1-オン、9-アミノ-2-[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)エチル]-1,2,3,4-テトラヒドロアクリジン-1-オン、9-メトキシ-2-[4-(1-ベンジルピペリジル)エチル]-2,3-ジヒドロピロ[3,4-b]キノリン-1-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-279355号公報(EP-A-481429)

59

に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0074】16) 式

【化70】



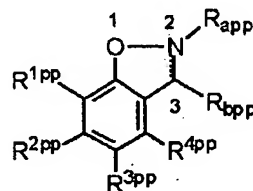
〔式中、R₀₀は水素、アルキル、アルケニル、シクロアルキルアルキル、フェニルアルキル、ナフチルアルキル、シクロアルキルアルケニル、フェニルアルケニルまたはナフチルアルケニル；R¹⁰⁰、R²⁰⁰、R³⁰⁰およびR⁴⁰⁰は同一または異なって、それぞれ水素、ハロゲン、アルキル、フェニル、フェニルアルキル、アルコキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、フェニルアルコキシ、フェノキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールオキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、-NHCO R⁵⁰⁰、-S(O)_{m00}R⁵⁰⁰、-NHSO₂R⁵⁰⁰、-CONR⁶⁰⁰R⁷⁰⁰、-NR⁶⁰⁰R⁷⁰⁰、-OCONR⁶⁰⁰R⁷⁰⁰、-OCSNR⁶⁰⁰R⁷⁰⁰、-SO₂NR⁶⁰⁰R⁷⁰⁰または-COOR⁸⁰⁰；またはR¹⁰⁰、R²⁰⁰、R³⁰⁰およびR⁴⁰⁰の隣接するものが相互に結合して、置換基を有してもよい-O(CH₂)_{p00}、-O(CH₂)_{q00}O、-O(CH₂)_{r00}N(R⁹⁰⁰)-、-O(CH₂)_{s00}CON(R⁹⁰⁰)-、-N(R⁹⁰⁰)CO-CH=CH-またはベンゼン環若しくは複素芳香環を形成する基を示す（ここで、R⁵⁰⁰は、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキル；R⁶⁰⁰およびR⁷⁰⁰は同一または異なって、それぞれ水素、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキルを示すか、隣接する窒素原子を結合して複素環を形成する基；R⁸⁰⁰は、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキル；R⁹⁰⁰は、水素、アルキル、フェニルアルキルまたはアシル；m₀₀は、0、1または2；p₀₀、q₀₀、r₀₀およびs₀₀は同一または異なって、1、2、または3を示す）；A₀₀は直鎖または分枝鎖状のアルキレン；n₀₀は1、2、または3；上記定義中、アルキル、アルケニル、アルコキシ、フェニル、フェノキシ、シクロアルキルアルキル、フェニルアルキル、ナフチルアルキル、シクロアルキルアルケニル、フェニルアルケニル、ナフチルアルケニル、フェニルアルコキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、ベンゼン環および複素芳香環は、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、-NHCO R⁵⁰⁰、-S(O)_mR⁵⁰⁰、-NHSO₂R⁵⁰⁰

60

500、-CONR⁶⁰⁰R⁷⁰⁰、-NR⁶⁰⁰R⁷⁰⁰、-OCONR⁶⁰⁰R⁷⁰⁰、-OCSNR⁶⁰⁰R⁷⁰⁰、-SO₂NR⁶⁰⁰R⁷⁰⁰または-COOR⁸⁰⁰（ここで、R⁵⁰⁰、R⁶⁰⁰、R⁷⁰⁰、R⁸⁰⁰およびm₀₀は上記と同義である）から選ばれる1ないし3個の置換基を有していてもよい。）で表される化合物またはその塩。具体例としては、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6,7-ジメトキシ-1,2-ベンゾイソオキサゾール、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6-(N-メチルアセトアミノ)-1,2-ベンゾイソオキサゾール等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-320160号公報(WO 93/04063)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

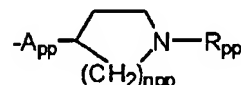
【0075】17) 式

【化71】



〔式中、2位と3位の間の結合が単結合を示すとき、R_{app}は式

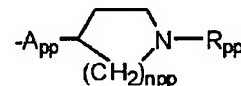
【化72】



〔式中、R_{pp}は水素、アルキル、アルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルケニル、フェニルアルキル、フェニルアルケニル、ナフチルアルキルまたはナフチルアルケニル；Appは直鎖または分枝鎖状のアルキレン；n_{pp}は1、2、または3を示す）により表される基を示し、R_{bpp}は酸素を示す。

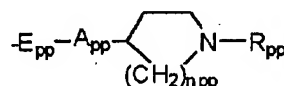
【0076】2位と3位の間の結合が二重結合を示すとき、R_{app}は存在せず、R_{bpp}は式

【化73】



〔式中の各記号は上記と同義である）により表される基または式

【化74】



〔式中、E_{pp}は酸素、硫黄を示し、他の各記号は上記と同義である）により表される基；R^{1pp}、R^{2pp}、R^{3pp}およびR^{4pp}は同一または異なっ

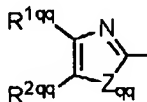
て、それぞれ水素、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、フェニル、フェニルアルキル、フェニルアルコキシ、フェノキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールオキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、 $-\text{NH}$ COR^{5pp} 、 $-\text{S}(\text{O})_{mpp} \text{R}^{5pp}$ 、 $-\text{NHSO}_2 \text{R}^{5pp}$ 、 $-\text{CONR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{NR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{OCSNR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ または $-\text{COOR}^{8pp}$ を示す。(R^{5pp} は、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキル; R^{6pp} および R^{7pp} は同一または異なって、それぞれ水素、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキルを示すか、隣接する窒素原子と結合して複素環を形成する基; R^{8pp} は、水素、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキル; mpp は、0、1または2を示す; 上記定義中、アルキル、アルケニル、アルコキシ、フェニル、フェニルアルキル、フェニルアルケニル、フェニルアルコキシ、フェノキシ、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルケニル、ナフチルアルキル、ナフチルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシおよびヘテロアリールオキシは、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、 $-\text{NHCOR}^{5pp}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_{mpp} \text{R}^{5pp}$ 、 $-\text{NHSO}_2 \text{R}^{5pp}$ 、 $-\text{CONR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{NR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{OCONR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{OCSNR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ または $-\text{COOR}^{8pp}$ (R^{5pp}、R^{6pp}、R^{7pp}、R^{8pp} および mpp は上記と同意義である) から選ばれる1ないし3個の置換基を有していてもよい。) で表される化合物またはその塩。具体例としては、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6,7-ジメトキシ-1,2-ベンゾイソオキサゾール、6-ベンゾイルアミノ-2-[3-(1-ベンジル-4-ピペリジル)プロピル]-1,2-ベンゾイソオキサゾール-3(2H)-オン、6-ベンゾイルアミノ-2-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-1,2-ベンゾイソオキサゾール-3(2H)-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平6-41125号公報(WO 93/04063)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0077】18) 式

Mqq-Wqq-Yqq-Aqq-Qqq

(式中、Mqqは式:

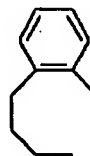
【化75】



(式中、R^{1qq} は水素、低級アルキル、置換基を有し

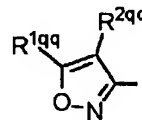
ていてもよい複素環基または置換基を有していてもよいアリール; R^{2qq} は、水素、低級アルキル、置換基を有していてもよい複素環基または置換基を有していてもよいアリールを表わすか、または、R^{1qq} と R^{2qq} が互いに結合して、式:

【化76】



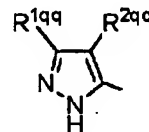
で表される基を形成; Zqqは、SまたはOをそれぞれ示す) で表される基、式:

【化77】



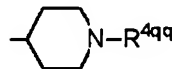
(式中、R^{1qq} および R^{2qq} は上記と同意義を示す) で表される基、または式:

【化78】



(式中、R^{1qq} および R^{2qq} は上記と同意義を示す) で表される基; Wqqは、結合、低級アルキレンまたは低級アルケニレン; Yqqは、低級アルキレン、 $-\text{NH}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CONR}^{3qq}-$ (式中、R^{3qq} は水素または低級アルキルを示す) の基または式: $-\text{CHR}^{7qq}-$ (式中、R^{7qq} はヒドロキシまたは保護されたヒドロキシを示す) の基; Aqqは、結合または低級アルキレン; Qqqは、式: $-\text{NR}^{8qq} \text{R}^{9qq}$ (式中、R^{8qq} は低級アルキル; R^{9qq} はアル(低級)アルキルを示す) の基または式:

【化79】



(式中、R^{4qq} は低級アルキルまたは置換基を有していてもよいアル(低級)アルキルを示す) で表される基をそれぞれ示す。) で表される化合物またはその塩。具体例としては、4-(ピリジン-3-イル)-5-メチル-2-[[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)エチル]カルバモイル]チアゾール、2-[[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)エチル]カルバモイル]-4-(4-クロロフェニル)-5-メチルオキサゾール、5-[[2-(1-ベンジルピペリジン-

63

4-イル)エチル]カルバモイル]-3-(4-ニトロフェニル)ピラゾール等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-345772号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

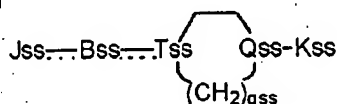
【0078】19)式

$R_{1rr} - Qrr - Zrr - Xrr - Arr - Mrr$

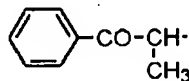
〔式中、 R_{1rr} は低級アルキル、置換基を有していてもよい複素環基、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアル(低級)アルキルまたはアル(低級)アルケニル; Qrr はオキサジアゾールジイル; Zrr は結合またはビニル; Xrr は結合、式: $-CO-NR_{4rr}-$ (式中、 R_{4rr} は水素または低級アルキルを示す)、式: $-CHR_{8rr}-$ (式中、 R_{8rr} はヒドロキシまたは保護されたヒドロキシを示す)、 $-CO-$ または $-NHCO-$; Arr は結合、低級アルキレンまたは低級アルケニレン; Mrr は、低級アルキル、イミノ保護基および置換基を有していてもよいアル(低級)アルキルからなる群から選ばれる1個の置換基を有していてもよい少なくとも1個の窒素原子を含む複素環基をそれぞれ示す。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、5-(キヌクリジン-3-イル)-3-[[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)エチル]カルバモイル]-1,2,4-オキサジアゾール、3-[[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)エチル]カルバモイル]-5-(4-ニトロフェニル)-1,2,4-オキサジアゾール等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平7-502529号公報(WO 93/13083)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0079】20)式

【化80】



〔式中、 Jss は(a)置換若しくは無置換の次に示す基; (1)フェニル基、(2)ピリジル基、(3)ピラジリル基、(4)キノリル基、(5)シクロヘキシル基、(6)キノキサリル基または(7)フリル基、(b)フェニル基が置換されていてもよい次の群から選択された一価または二価の基; (1)インダニル、(2)インダノニル、(3)インデニル、(4)インデノニル、(5)インダンジオニル、(6)テトラロニル、(7)ベンズスベロニル、(8)インダノリル、(9)式【化81】



で示される基、(c)環状アミド化合物から誘導される一価の基、(d)低級アルキル基、または(e)式R

64

1 $_{ss}$ -CH=CH- (式中、 R_{1ss} は水素原子または低級アルコキシカルボニル基を意味する)で示される基を意味する。 Bss は式 $-(CHR_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-CO-(CHR_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-NR_{3ss}-(CHR_{2ss})_{nss}-$ (式中、 R_{3ss} は水素原子、低級アルキル基、アシル基、低級アルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基またはベンジル基を意味する)で示される基、式 $-CO-NR_{4ss}-(CHR_{2ss})_{nss}-$ (式中、 R_{4ss} は水素原子、低級アルキル基またはフェニル基を意味する)で示される基、式 $-CH=CH-(CHR_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-O-COO-(CHR_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-O-CO-NH-(CHR_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-NH-CO-(CHR_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-CH_2-CO-NH-(CHR_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-(CH_2)_2-CO-NH-(CHR_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-C(OH)H-(CHR_{2ss})_{nss}-$ で示される基 (以上の式中、 nss は0または1~10の整数を意味する。 R_{2ss} は式 $-(CHR_{2ss})_{nss}-$ で示されるアルキレン基が置換基を持たないか、または1つまたは1つ以上のメチル基を有しているような形で水素原子またはメチル基を意味する)、式 $=(CH-C(H)=CH)bss-$ (式中、 bss は1~3の整数を意味する)で示される基、式 $=CH-(CH_2)css-$ (式中、 css は0または1~9の整数を意味する)で示される基、式 $=(CH-CH)dss-$ (式中、 dss は0または1~5の整数を意味する)で示される基、式 $-CO-CH=CH-CH_2-$ で示される基、式 $-CO-CH_2-C(OH)H-CH_2-$ で示される基、式 $-C(CH_3)H-CO-NH-CH_2-$ で示される基、式 $-C(H)=CH-CO-NH-(CH_2)_2-$ で示される基、式 $-NH-$ で示される基、式 $-O-$ で示される基、式 $-S-$ で示される基、ジアルキルアミノアルキルカルボニル基または低級アルコキシカルボニル基を意味する。

【0080】 Tss は窒素原子または炭素原子を意味する。 Qss は窒素原子、炭素原子または式 $>N \rightarrow O$ で示される基を意味する。 Kss は水素原子、置換若しくは無置換のフェニル基、フェニル基が置換されていてもよいアリールアルキル基、フェニル基が置換されていてもよいシナミル基、低級アルキル基、ピリジリルメチル基、シクロアルキルアルキル基、アダマンタンメチル基、フリルメチル基、シクロアルキル基、低級アルコキシカルボニル基またはアシル基を意味する。 qss は1~3の整数を意味する。式中、

【化82】

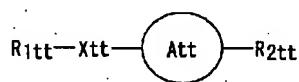
は単結合若しくは二重結合を意味する。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-ベンジル-4-

65

-〔(5, 6-ジメトキシ-1-インダノン)-2-イル〕メチルピペリジン、N-〔4'-(1'-ベンジルピペリジル)エチル]-2-キノキサリンカルボン酸アミド、4-〔4'-(N-ベンジル)ピペリジル]-p-メトキシブチロフェノン、1-〔4'-(1'-ベンジルピペリジン)エチル]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5H-1-ベンツアゼピン-2-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開昭64-79151号公報(USP 4, 895, 841)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

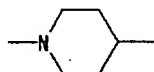
【008.1】·21)式

【化83】



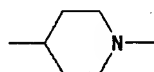
〔式中、 $R_{1\text{ }t\text{ }t}$ は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、ピラジン、インドール、アントラキノ、キノリン、置換基を有していてもよいフタルイミド、ホモフタルイミド、ピリジンカルボン酸イミド、ピリジン-N-オキサイド、ピラジンカルボン酸イミド、ナフタレンジカルボン酸イミド、置換基を有していてもよいキナゾリジンジオン、1, 8-ナフタルイミド、ビシクロ〔2. 2. 2〕オクト-5-エン-2, 3-ジカルボン酸イミドおよびピロメイルイミドから選ばれるものから誘導される一価の基； X_{tt} は式 $-(CH_2)_{mtt}-$ (式中、 mtt は 0~7 の整数を示す) で示される基、式 $-O(CH_2)_n-$ で示される基、式 $-S(CH_2)_n-$ で示される基、式 $-NH(CH_2)_n-$ で示される基、式 $-SO_2NH(CH_2)_n-$ で示される基、式 $-NHCO(CH_2)_n-$ で示される基、式 $-NH(CH_2)_n-CO-$ で示される基、式 $-COO(CH_2)_n-$ で示される基、式 $-CH_2NH(CH_2)_n-$ で示される基、式 $-CONR_3-$ (式中、 R_3 は低級アルキルまたはベンジル基を意味する) で示される基、式 $-O-CH_2CH_2CH(CH_3)-$ で示される基、式 $-O-CH(CH_3)CH_2CH_2-$ で示される基、式 $-O-CH_2CH_2CH=$ で示される基、式 $-O-CH_2CH(OH)CH_2-$ で示される基；環 A_{tt} は式

【化84】



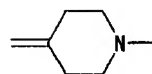
で示される基、式

【化85】



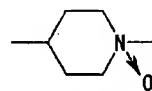
で示される基、式

【化86】



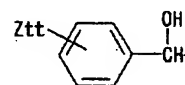
で示される基、または式

【化87】



10 示される基；R₂は水素原子、低級アルキル基、置換基を有していてもよいベンジル基、置換基を有していてもよいベンズイル基、ピリジル基、2-ヒドロキシエチル基、ピリジルメチル基、または式

【化88】



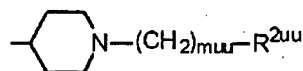
(式中、Zはハロゲン原子を意味する)で表される基を示す。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、N-メチル-N-[2-(1'-ベンジルピペリジン-4'-イル)エチル]-4-ベンジルスルホニルベンツアミド、N-[2-(N'-ベンジルピペリジン-4'-イル)エチル]-4-ニトロフタルイミド、N-[2-(N'-ベンジルピペリジン-4'-イル)エチル]-1,8-ナフタルイミド等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開昭62-234065号公報(E P-A-229391)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0082】22)式

$$30 \quad R^1 \text{ u u } - (\dot{C}H_2)_n \text{ u u } - Z \text{ u u}$$

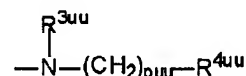
〔式中、R¹、R²は置換基を有していてもよい環状アミド化合物から誘導される基；n¹は0または1～10の整数；Z¹は、 \bigcirc 式

【化89】



(式中、 R^{200} は置換基を有していてもよいアリール基、シクロアルキル基または複素環基； m は1～6の整数を意味する)で示される基、または②式

【化90】

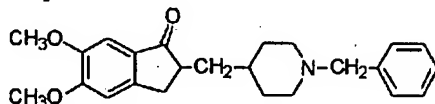


(式中、 R^{3uu} は水素原子または低級アルキル基; R^{4uu} は置換基を有していてもよいアリール基、シクロアルキル基または複素環基; puu は1~6の整数を意味する)で示される基を意味する。但し、 R^{1uu} の定義における置換基を有していてもよい環状アミド化合物がキナゾリジーンオンまたはキナゾリジーンジオンである

場合、Zuuの定義において、R^{2uu} および R^{4uu} がアリール基である場合は除く。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-5-メトキシ-2H-3,4-ジヒドロ-1,3-ベンツオキサジン-2-オン、3-[2-[1-(4-ピリジルメチル)-4-ピペリジル]エチル]-2H-3,4-ジヒドロ-1,3-ベンツオキサジン-2-オン、3-[2-[1-(1,3-ジオキサラン-2-イルメチル)-4-ピペリジル]エチル]-5-メトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロキナゾリン-2,4-ジオン、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6-メトキシ-2H-3,4-ジヒドロ-1,3-ベンツオキサジン-2,4-ジオン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平4-235161号公報(EP-A-468187)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

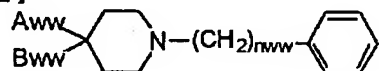
【0083】23) 式

【化91】



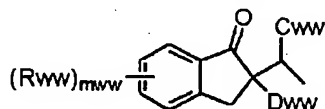
で表される光学活性インダノン誘導体またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平4-21670号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。24) 式

【化92】

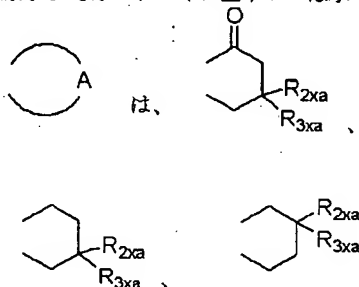


【式中、nwwは0または1~2の整数；Awwは式

【化93】

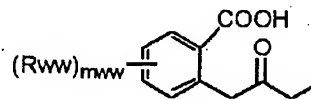


【式中、Cwwは水素原子またはヒドロキシ基；Dwwは水*

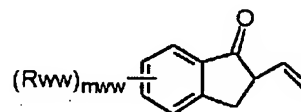


【式中、R_{2xa}およびR_{3xa}はそれぞれ低級アルキル基を意味する。)を意味する。]で表される化合物またはその塩。具体例としては、9-アミノ-6-クロロ-3, ※50

* 素原子または低級ヒドロキシアルキル基；R_{ww}は同一または異なって水素原子、低級アルキル基および低級アルコキシ基から選ばれる基；mwwは0または1~4の整数を意味する)で表される基、または式【化94】



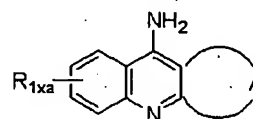
10 (式中、各記号は上記と同意義)で表される基；B_{ww}は水素原子またはヒドロキシ基を示し；A_{ww}とB_{ww}が二重結合を形成し、式【化95】



(式中、各記号は上記と同意義)で表される基を形成してもよい。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-ベンジル-4-(5,6-ジメトキシ-1-インダノン-2-イル)ヒドロキシメチルピペリジン、1-ベンジル-4-(5,6-ジメトキシ-2-ヒドロキシメチル-1-インダノン-2-イル)メチルピペリジン、1-ベンジル-4-[3-(4,5-ジメトキシ-2-カルボキシフェニル)-2-オキソ]プロピルピペリジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平9-268176号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

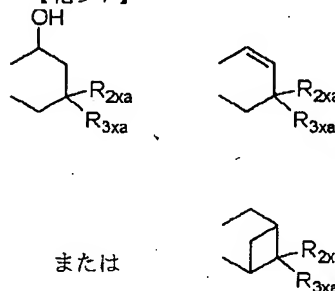
【0084】25) 式

30 【化96】



【式中、R_{1xa}は水素、ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルキル基またはモノ(またはジまたはトリ)ハロ(低級)アルキル基、

【化97】

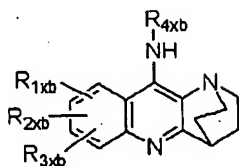


※3-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロアクリジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平2-167267号公報に記載の方法またはそれに準じ

た方法により製造される。

【0085】26) 式

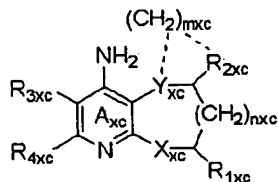
【化98】



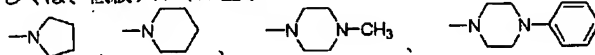
【式中、 R_{1xb} 、 R_{2xb} および R_{3xb} はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基、低級アルキル基、低級シクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシメチル基、低級アルキルチオ基、ニトロ基、アミノ基、低級アルカノイルアミノ基、低級アルキルアミノ基、ヒドロキシル基、フェニル基またはハロゲン原子、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたフェニル基を表わし、 R_{4xb} は水素原子、低級アルキル基、アラルキル基、ジアラルキル基、または式 $R_{5xb}-CO-$ で表される基（ R_{5xb} は低級アルキル基、低級シクロアルキル基、アラルキル基、フェニル基またはハロゲン原子、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたフェニル基を表わす。）を表わす。】で表されるアミノアザアクリジン誘導体またはその塩。具体例としては、9-アミノ-8-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-エタノ-1-アザアクリジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開昭63-166881号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0086】27) 式

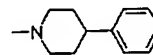
【化99】



【式中、 R_{1xc} は、水素原子または低級アルキル基を、 R_{2xc} は独立して水素原子若しくは、低級アルキル基を *



または



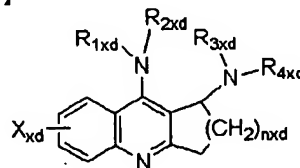
を構成する。】で表される化合物、その立体異性体またはその塩。具体的には、1-(1-ピペリジニル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-アクリジナミンやN-1-エチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 9-アクリジンジアミン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平3-153667号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

※50

*示すか、または R_{5xc} と一緒に環状のアルキレン鎖を示す。 R_{3xc} および R_{4xc} は、独立して各々水素原子を示すか、または一緒に環 A_{xc} とともにキノリン環若しくは、テトラヒドロキノリン環を構成する。 X_{xc} は酸素原子、硫黄原子または $N-R_{5xc}$ を示し、 R_{5xc} は水素原子、または低級アルキル基を示す。 Y_{xc} は酸素原子または $N-R_{5xc}$ を示し、 R_{5xc} は独立して、水素原子若しくは低級アルキル基を示すか、または R_{2xc} と一緒に環状アルキレンを示す。 nxc は0または1を、 mxc は0~4の整数を示す。】で表される化合物またはその塩。具体的には、4'-アミノキノリノ[2, 3-b]-4-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 4-オキサジンや4'-アミノ-5', 6', 7', 8'-テトラヒドロキノリノ[2, 3-b]-4-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 4-オキサジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平2-96580号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0087】28) 式

20 【化100】

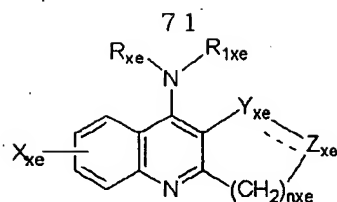


【式中、 nxd は1, 2または3であり、 Xxd は水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルであり； R_{1xd} および R_{2xd} はそれぞれ独立して水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキルであるが、しかし両者は同時にアリール低級アルキルであることはできないものであり； R_{3xd} および R_{4xd} はそれぞれ独立して水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、ホルミルまたは低級アルキルカルボニルであるかまたは基 $-NR_{3xd}R_{4xd}$ が全体として次の基

【化101】

※【0088】29) 式

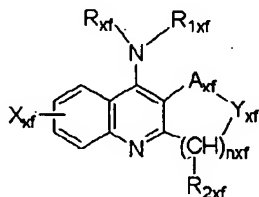
【化102】



〔式中、 n_{xe} は1, 2または3であり、 X_{xe} は水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、 $NHCOR_{2xe}$ （ここで R_{2xe} は $C_1 \sim C_6$ -アルキルである）または $NR_{3xe}R_{4xe}$ （ここで R_{3xe} および R_{4xe} は独立して水素または $C_1 \sim C_6$ -アルキルである）であり、 R_{xe} は水素または $C_1 \sim C_6$ -アルキルであり、 R_{1xe} は水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ジ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、アリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ジアリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、フリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、チエニール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、酸素架橋されたアリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、酸素架橋されたジアリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、酸素架橋されたフリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、または酸素架橋されたチエニール- $C_1 \sim C_6$ -アルキルであり、 Y_{xe} は $C=O$ または $CR_{5xe}OH$ （ここで R_{5xe} は水素または $C_1 \sim C_6$ -アルキルである）であり、そして Z_{xe} は CH_2 または $C=CR_{6xe}R_{7xe}$ （ここで R_{6xe} および R_{7xe} は独立して水素または $C_1 \sim C_6$ -アルキルである）であるか、または Y_{xe} と Z_{xe} が一緒になって $CR_{5xe}=CH$ （ここで CR_{5xe} および CH はそれぞれ Y_{xe} と Z_{xe} に対応する）を構成するものとする。〕で表される化合物、その光学対象体またはその塩。具体的には、9-アミノ-3, 4-ジヒドロアクリジン-1 (2H)-オンまたは9-アミノ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロアクリジン-1-オール等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開昭61-148154号公報または特告平5-41141号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0089】30) 式

【化103】

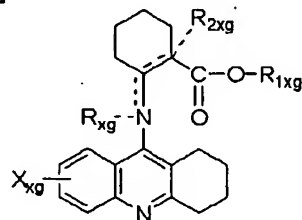


〔式中、 n_{xf} は1~4であり、 R_{xf} は水素、低級アルキルまたは低級アルキルカルボニルであり、 R_{1xf} は水素、低級アルキル、低級アルキルカルボニル、アリール、ジ低級アルキルアミノ低級アルキル、アリール低級アルキル、ジアリール低級アルキル、酸素架橋されたアリール低級アルキル、または酸素架橋されたジアリール

低級アルキルであり、 A_{xf} は直接の結合または $(CHR_{3xf})_{mxf}$ であり、 m_{xf} は1~3であり、 X_{xf} は水素、低級アルキル、シクロアルキル、低級アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、ホルミル、低級アルキルカルボニル、アリールカルボニル、 $-SH$ 、低級アルキルチオ、 $-NHCOR_{4xf}$ または $NR_{5xf}R_{6xf}$ であり、上記式中 R_{4xf} は水素または低級アルキルであり、 R_{5xf} および R_{6xf} は各々独立して水素、低級アルキルまたはシクロアルキルであり、 Y_{xf} は O 、 S または NR_{7xf} であり、各 R_{2xf} 、各 R_{3xf} および R_{7xf} は独立して水素若しくは低級アルキルであるか、または2つが同時に、少なくとも5つの原子からなる環の一部をなすメチレン若しくはエチレン基を形成し；但し A_{xf} が CH_2 で、 Y_{xf} が NCH_3 で、 $(CHR_{2xf})_{nxf}$ が CH_2CH_2 で、 X_{xf} が H 、 CH_3 、 Cl 、 Br または NO_2 で、 R_{xf} が H である場合には、 R_{1xf} は H 、メチル、エチル、プロピル、ブチルまたはベンジルではなく、 A_{xf} が $-CH_2-$ または $CHR'-$ で、 Y_{xf} が NH または NR' で、 $(CHR_{2xf})_{nxf}$ が $-CH_2CH_2-$ または $CH_2CHR'-$ である場合には、基- $NR_{xf}R_{1xf}$ は $-NH_2$ 、 $-NHC_6H_5$ またはジ低級アルキルアミノ低級アルキルアミノではなく、各 R' は独立して低級アルキルであり、 A_{xf} が CH_2 で、 Y_{xf} が NH または NR' で、 $(CHR_{2xf})_{nxf}$ が $-(CH_2)_3-$ または $CHR'CH_2CH_2-$ である場合には、基- $NR_{xf}R_{1xf}$ は $-NH_2$ ではなく、 A_{xf} が $-CH_2CH_2-$ で、 Y_{xf} が NH または NR' で、 $(CHR_{2xf})_{nxf}$ が $-CH_2CH_2-$ または $CHR'CH_2-$ である場合には、基- $NR_{xf}R_{1xf}$ は $-NH_2$ ではない。〕で示される化合物、その立体、光学若しくは幾何異性体またはその塩。具体的には、9-アミノ-2, 3-ジヒドロキノリン[3, 2-b]キノリンまたは10-アミノ-3, 4-ジヒドロ-1H-チオピラノ[4, 3-b]キノリン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開昭63-284175号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0090】31) 式

【化104】

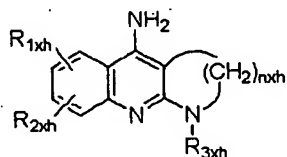


〔式中、 X_{xf} は水素、低級アルキル、低級アルコキシまたはハロゲンであり、 R_{xf} は、存在する場合には、水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキルであり、 R_{1xf} は、水素、低級アルキルまたはアリール低級アル

キルであり；そして R_{2xs} は、存在する場合には、水素または低級アルキルである。]で表される化合物またはその塩。具体的には、2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-アクリジンイミノ)-シクロヘキサンカルボン酸や2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-アクリジンイミノ)-シクロヘキサンカルボン酸エチルエステル等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平3-95161号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0091】32)式

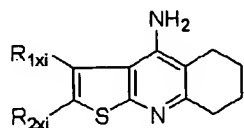
【化105】



[式中、 R_{1xh} および R_{2xh} はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシル基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基、ニトロ基、アミノ基または低級アルカノイルアミノ基を表わし、 R_{3xh} は、水素原子；炭素数1~15のアルキル基；シクロアルキル基；ハロゲン、低級アルキル基若しくは低級アルコキシで置換されていてもよい炭素数7~15のアラルキル基；炭素数2~15のアルカノイル基；またはハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ、ヒドロキシル若しくはアミノで置換されていてもよいベンゾイル基を表わし、 $n x h$ は2~5の整数を表わす。]で示される化合物またはその塩。具体的には、6-アミノ-1-ベンジル-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-アゼピノ[2, 3-b]キノリンや5-アミノ-6-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロベンゾ[d][1, 8]ナフチリジンが挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平3-220189号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0092】33)式

【化106】

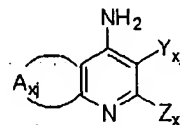


[式中、 R_{1xi} 、 R_{2xi} はそれぞれ水素原子、炭素数1~4の直鎖および分枝アルキル基を表わす。但しともに水素原子となることはない。]で示される4-アミノ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロチエノ[2, 3-b]キノリン誘導体またはその塩。具体的には、4-アミノ-2, 3-ジメチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロチエノ[2, 3-b]キノリン等が挙げられる。上記化合物

またはその塩は、特開平4-134083号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

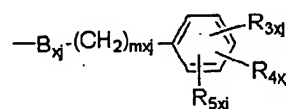
【0093】34)式

【化107】



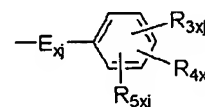
- 10 [式中、 $A x j$ は式 $-(CH_2) n x j-$ (但し $n x j$ は3~5の整数である)のアルキレン基を表わして、これに隣接するピリジン核の隣り合う2個の炭素原子に結合して1個のシクロアルケノ基を形成するか、若しくは $A x j$ はこれに隣接するピリジン核の隣り合う2個の炭素原子と連合して1個のベンゼン環を形成する基であり、そして(i) $A x j$ がシクロアルケノ基を形成する場合には $Y x j$ は水素原子、ハロゲン原子、 $C1 \sim C6$ の低級アルキル基またはアミノ基を表わし、かつ $Z x j$ は水素原子、水酸基、ハロゲン原子、アミノ基、式 $-N R_{1xj} R_{2xj}$ (R_{1xj} 、 R_{2xj} は同一でも異なってもよく、低級アルキル基またはベンジル基を表わす)の基、ピロリジル基、ピペリジル基、ピペラジル基、N-置換ピペラジル基、ピリジル基または次式

【化108】



- (式中、Bは酸素原子または硫黄原子を示し、 $m x j$ は0~2の整数を示し、 R_{3xj} 、 R_{4xj} 、 R_{5xj} は同一でも異なってもよく水素原子、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、直鎖または分枝の($C1 \sim C6$)低級アルキル基、アミノ基、アシルアミノ基を表わす)の基を示すかまたは $Z x j$ はピリジルチオ基の基を示し、また(ii) $A x j$ がベンゼン環を形成する場合には、 $Y x j$ は水素原子または $C1 \sim C6$ の低級アルキル基を示しかつ $Z x j$ は式 $-CONR_{6xj} R_{7xj}$ (但し R_{6xj} および R_{7xj} はそれぞれ水素原子または $C1 \sim C6$ の低級アルキル基を表わし、あるいは R_{6xj} および R_{7xj} は共同して $C3 \sim C6$ のシクロアルキル基を形成する)の基を示すか、または $Z x j$ は式

【化109】



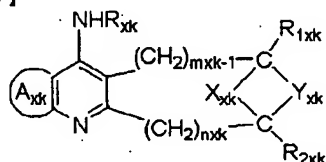
(式中、 $E x j$ は $C2 \sim C6$ のアルキレン基または式 $-(CH=CH) p x j-$ (但し $p x j$ は1または2を表わす)の基を示し、 R_{3xj} 、 R_{4xj} および R_{5xj} は前期の意味を表わす)の基を示す。]で表される4-アミノ-

75

2, 3-シクロアルケノピリジンおよび4-アミノキノリン誘導体またはそれらの塩。具体的には、4-アミノ-2-(N-メチルカルバモイル)キノリン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平4-66571号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0094】35) 式

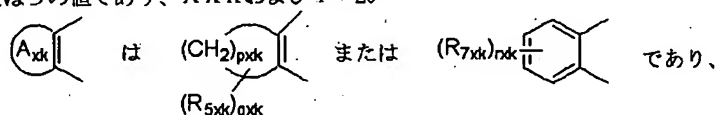
【化110】



〔式中、R_xkは水素、アルキル、アラルキルまたはアシルであり、R_1xkおよびR_2xkは、独立して、水素、アルキル、アラルキル、アルコキシ、アルコシカルボニル、アミノまたは1または2個のアルキル、アラルキルまたはアシル基で置換されたアミノであり、m_xkおよびn_xkは1、2または3の値であり、X_xkおよびY_xkは、独立して、2個の炭素間の結合、酸素または硫黄原子、基N-R_3xk（式中基R_3xkはR_xkについて上記において定義した意味を有する）または1〜5個の炭素原子を含有しかつ1または2以上の置換基R_4xkを含有できるアルキレンまたはアルケニレン架橋（ここでR_4xkは、独立して、水素、1〜4個の炭素原子を有する直鎖状若しくは分枝鎖状の低級アルキル、アルケニルまたはアルキリデン、フェニルまたは1または2以上の1〜4個の炭素原子を有する低級アルコキシまたはハロゲン基で置換されたフェニル、アラルキル、1〜4個の炭素原子を有する低級アルコキシ、およびヒドロキシルである）であり、そしてX_xkがアルケニレン基であるとき、後者は飽和若しくは不飽和の炭素環式または複素環式環系に融合することができ、上記環は1または2以上の基R_5xk（R_5xkは水素、1〜4個の炭素原子を有する低級アルキルまたは低級アルコキシまたはハロゲンである）で置換することができ、そして

* x kは、独立して、2個の炭素間の結合、酸素または硫黄原子、基N-R_3xk（式中基R_3xkはR_xkについて上記において定義した意味を有する）または1〜5個の炭素原子を含有しかつ1または2以上の置換基R_4xkを含有できるアルキレンまたはアルケニレン架橋（ここでR_4xkは、独立して、水素、1〜4個の炭素原子を有する直鎖状若しくは分枝鎖状の低級アルキル、アルケニルまたはアルキリデン、フェニルまたは1または2以上の1〜4個の炭素原子を有する低級アルコキシまたはハロゲン基で置換されたフェニル、アラルキル、1〜4個の炭素原子を有する低級アルコキシ、およびヒドロキシルである）であり、そしてX_xkがアルケニレン基であるとき、後者は飽和若しくは不飽和の炭素環式または複素環式環系に融合することができ、上記環は1または2以上の基R_5xk（R_5xkは水素、1〜4個の炭素原子を有する低級アルキルまたは低級アルコキシまたはハロゲンである）で置換することができ、そして

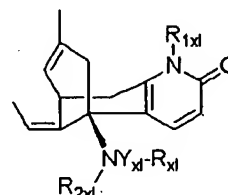
【化111】



p_xk, q_xkおよびr_xkは1または1より大きい値であり、そしてR_6xkまたはR_7xkは、独立して、水素、ハロゲン、低級アルコキシまたは低級アルキルであることができる置換基である。〕の多環式アミノピリジン化合物またはその塩。具体的には、(+)-12-アミノ-6, 7, 10, 11-テトラヒドロ-9-エチル-7, 11-メタノシクロオクタ[b]キノリンや(+)-12-アミノ-6, 7, 10, 11-テトラヒドロ-9-メチル-7, 11-メタノシクロオクタ[b]キノリン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平11-500144号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

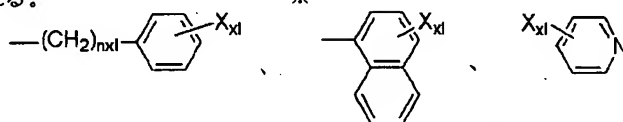
※【0095】36) 式

【化112】



〔式中、Y_x1は-C=Oであるか、またはR_2x1、Yは=CHであり、R_x1はC_1〜C_5 低級アルキル、

【化113】



（ここで、n_x1=0または1であり、X_x1は水素、C_1〜C_5 低級アルキル、C_1〜C_5 低級アルコキシ、ニトロ、ハロゲン、カルボキシ、アルコシカルボニル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシ、ビス-C_1〜C_5 低級アルキル置換アミノを表わす）、-(CH_2)_m_x1 COOZ_x1（ここで、m_x1=0〜5であり、Z_x1は水素またはC_1〜C_5 低級アルキルを表わす）、-CH=CH-G_x1基（ここで、G_x1はフェニル、フラニル、カルボキシ、アルコシカルボニルを表わす）、および窒素原子においてC_1〜C_5 低級アル★50

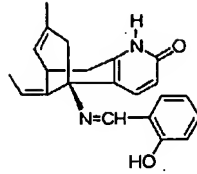
★キルにより置換されたジヒドロ若しくはテトラヒドロピリジンを表わし、R_1x1は水素、C_1〜C_5 低級アルキル、ピリドイルおよびC_1〜C_5 低級アルコキシ置換ベンゾイルを表し、R_2x1は水素およびC_1〜C_5 低級アルキルを表わす。〕で表される化合物またはその塩。具体的には、下式の化合物等が挙げられる。

【化114】

(40)

特開2001-335576

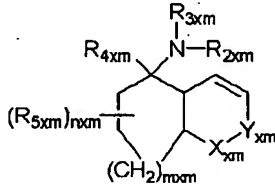
77



上記化合物またはその塩は、特表平10-511651号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

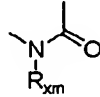
【0096】37)式

【化115】



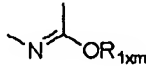
【式中、Xxm-Yxmは、式

【化116】

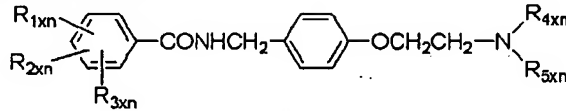


(式中、Rxmは水素、低級アルキル、低級アルゲニル、低級アルキニルまたはアリール低級アルキルである)の基、または式

【化117】



(式中、R1xmは水素、低級アルキルまたはアリール低 *



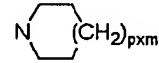
【式中、R1xn、R2xnおよびR3xnはそれぞれ水素原子；低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、低級アルキル基が置換していても良いアミノ基、低級アルキル基が置換していても良いスルファモイル基を表わすか、若しくはR1xnおよびR2xnがいっしょになってメチレンジオキシ基を表わし、R4xnおよびR5xnはそれぞれ低級アルキル基または炭素数3から6個のシクロアルキル基、若しくはR4xnおよびR5xnがいっしょになってその置換する窒素原子と共に、それぞれ低級アルキル基が置換していても良い1-ピロリジニル基、1-ピペリジニル基、1-ピペラジニル基、4-モルホリニル基を表わす。】で示される化合物またはその塩。具体的には、N-[4-[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル]-2-エトキシベンズアミドや4-アミノ-N-[4-[2-(ジメ

(40)

78

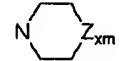
*級アルキルである)の基であり、R2xmおよびR3xmは、独立して水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、ジアリール低級アルキル、低級シクロアルケニル低級アルキル、低級アルコキシ、アリール低級アルコキシまたは低級アルカノイルであるか、またはR2xmおよびR3xmは、これらが結合している窒素原子と一緒に式

【化118】



10 (式中、pxmは0または1である)の基、式

【化119】



(式中、ZxmはO、Sまたは式NR6xm (R6xmは水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキルである)の基である)の基を形成し、R4xmは水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキルであり、R5xmは水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキルであり、mxmは0、1または2であり、そしてnxmは1または2である。]の化合物、その幾何学および光学異性体またはその塩。具体的には、N-(1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-5-メチル-2-オキソ-5-キノリニル)アセトアミドや5-[[2-(3,4-ジクロロフェニル)エチル]アミノ]-5,6,7,8-テトラヒドロ-1-メチル-2(1H)-キノリノン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平4-290872号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

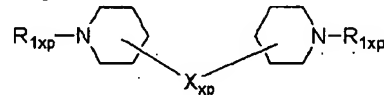
【0097】38)式

30 【化120】

※チルアミノ)エトキシ]ベンジル]-2-メトキシ-5-スルファモイルベンズアミド等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平2-231421号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

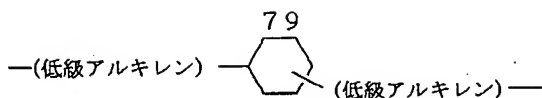
40 【0098】39)式

【化121】

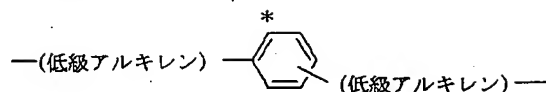


【式中、Xxpは炭素数1~10の直鎖または分枝状のアルキレン、

【化122】



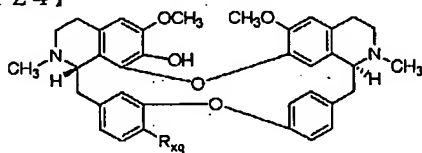
*または、
【化123】



を表わす。R_{1xp}はAr_{xp}-CHR_{2xp}- (但しAr_{xp}は無置換のフェニル基またはハロゲン原子、トリフルオロメチル基、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたフェニル基を表わし、R_{2xp}は水素原子または低級アルキル基を表わす。)、フェニル基が無置換またはハロゲン原子、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたシンナミル基、シクロアルキルメチル基または複素環芳香族基で置換されたメチル基を表わす。また、Xの2つのピペリジン環への結合部位は一方が2位なら他方は2'位、一方が3位なら他方は3'位、一方が4位なら他方は4'位である。]で示される化合物またはその塩。具体的には、1, 6-ジ- (1-ベンジル-4-ピペリジル) ヘキサンや1, 5-ジ- (1-ベンジル-4-ピペリジル) ペンタン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平4-18071号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0099】40) 式

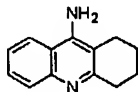
【化124】



[式中、R_{xq}は水酸基またはメトキシ基を示す。]で示される化合物またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平4-159225号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0100】41) 下式で表される9-アミノ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロアクリジンまたはその塩。

【化125】



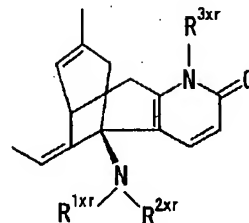
上記化合物またはその塩は、特開平4-346975号公報に記載の方法、該公報に引用された文献記載の方法、またはそれらに準じた方法により製造される。

【0101】42) 式

【化126】

※

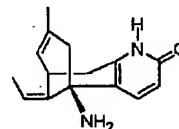
10



[式中、R^{1xr}、R^{2xr}およびR^{3xr}はそれぞれ水素原子または低級アルキル基を示す。]で表される化合物またはその塩。

【0102】下式で表されるフベルジンA (Huperzine A) またはその塩。

【化127】

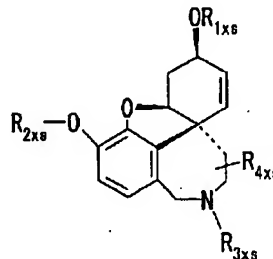


上記化合物またはその塩は、USP 5,177,082, J. Am. Chem. Soc., 1991, 113, p4695-4696、または、J. Am. Chem. Soc., 1989, 111, p4116-4117に記載の方法またはそれらに準じた方法により製造されるか、あるいは、中草薬の千層塔(トウゲシバ)から抽出後、分離して得られる。

30

【0103】43) 下式の構造を有しているガラントミンあるいはガラントミンの誘導体

【化128】



40

上式においてR_{1xs}およびR_{2xs}は同一のもの若しくは異なるものであり、それぞれ水素原子あるいは低級アルカノイル基のようなアシル基を意味しており、例えばアセチル基であり、あるいは例えばメチル、エチル、プロピルまたはイソプロピル等の直鎖あるいは枝分かれしたアルキル基である。R_{3xs}は直鎖または枝分かれしたアルキル基、アルケニル基あるいはアルカリル(alkaryl)基であり、これらの基は任意にハロゲン原子、あるいはシクロアルキル基、水酸基、アルコキシ基、ニトロ基、

※

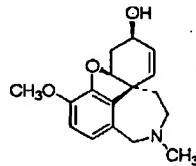
50

81

アミノ基、アミノアルキル基、アシルアミノ基、ヘテロアリール基、ヘテロアリール-アルキル基、アロイル基、アロイルアルキル基、あるいはシアノ基により置き換えられるものであり、 R_{4yb} は四つの環状骨格を形成している炭素の少なくとも一つに結合している水素原子あるいはハロゲン原子を意味している。但し R_4 が窒素原子に隣接した位置に存在している場合は、 R_4 は好ましくはハロゲン原子、ならびに例えば臭化水素酸塩、塩酸塩等のハロゲンの塩、硫酸メチルあるいはメチオグライドとは異なるものであることを条件とする。

【0104】具体的には、下式で表されるGalantamineまたはその塩が挙げられる。

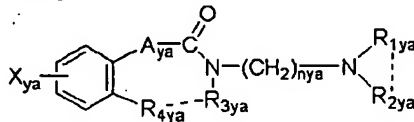
【化129】



上記化合物またはその塩は、特表平6-507617号、Heterocycles, 1977, 8, p277-282、または、J. Chem. Soc. (C), 1971, p1043-1047に記載の方法またはそれに準じた方法により製造されるか、あるいは、Galanthus nivalisやGalanthus waronowii等のユリ科植物から抽出後、分離して得られる。

【0105】44) 式

【化130】

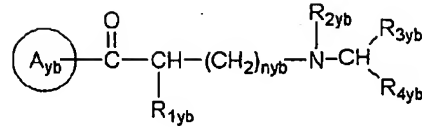


〔式中、 R_{1ya} と R_{2ya} は、それぞれ独立して、水素原子または、置換基を有していてもよい炭化水素残基を示すか、あるいは、隣接する窒素原子とともに縮合複素環基を形成し、 R_{3ya} と R_{4ya} は、 R_{3ya} が水素原子または、それぞれ置換基を有していてもよい炭化水素残基若しくはアシル基を示し、 R_{4ya} が水素原子を示すか、あるいは、 R_{3ya} と R_{4ya} が結合して $-(CH_2)mya-CO-$ 、 $-CO-(CH_2)mya-$ または $(CH_2)mya+1-$ (式中、 mya は0、1または2を示す)を形成し、 Aya は $-(CH_2)1ya-$ (式中、 $1ya$ は0、1または2を示す)または、 $-CH=CH-$ を示し、 Xya は1以上の置換基を示し、 nya は4ないし7の整数を示す。〕で表わされる置換アミン類またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平2-91052号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0106】45) 式

【化131】

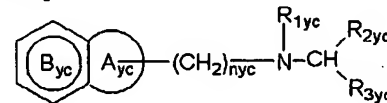
82



〔式中、環 Ayb は置換されていてもよく、環構成ヘテロ原子としてO、S、Nの1~2個を含んでいてもよい5~8員環状基を示し、 R_{1yb} は水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素残基を示し、 R_{2yb} は水素原子または低級アルキル基を示し、 R_{3yb} は置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 R_{4yb} は水素原子または低級アルキル基若しくは置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 nyb は2~7の整数を示す。〕で表されるアミノケトン誘導体またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平3-95143号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0107】46) 式

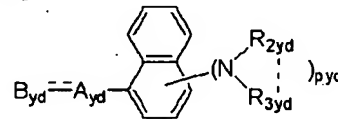
【化132】



〔式中、 R_{1yc} は水素原子または低級アルキル基を示し、 R_{2yc} は置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 R_{3yc} は水素原子または低級アルキル基若しくは置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 nyc は0~7の整数を示し、環 Ayc は置換されていてもよく、環構成ヘテロ原子としてO、Sの1または2個を含んでいてもよい5~8員環状基を示し、環 Byc は置換されていてもよいベンゼン環を示す。〕で表されるアラルキルアミン誘導体またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平3-141244号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0108】47) 式

【化133】



〔式中、 Bya は置換されていてもよい飽和または不飽和の5~7員アザ複素環状基を示し、 Aya は結合手または炭化水素残基、オキソ基、ヒドロキシイミノ基若しくはヒドロキシ基で置換されていてもよい二価または三価の脂肪族炭化水素残基を示し、

【化134】

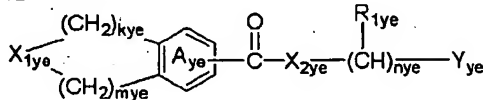
は単結合若しくは二重結合を示し (但し、 Aya が結合手を表わすときは、

【化135】

は単結合を表わす)、 R_{2ye} 、 R_{3ye} はそれぞれ独立して水素原子若しくは置換基を有していてもよい炭化水素残基を示すかまたは、隣接する窒素原子とともに環状アミノ基を形成してもよく、 pyd は1または2を示す。)で表されるアミノナフタレン化合物またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平3-223251号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0109】48)式

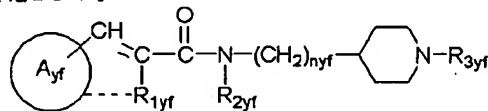
【化136】



(式中、 X_{1ye} は $R_{4ye}-N$ (R_{4ye} は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基または置換基を有していてもよいアシル基を示す)、酸素原子または硫黄原子を示し、 X_{2ye} は $R_{5ye}-N$ (R_{5ye} は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基または置換基を有していてもよいアシル基を示す)または酸素原子を示し、 A_{ye} はさらに置換基を有していてもよいベンゼン環を示し、 R_{1ye} は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基を示し、 R_{1ye} は nye の繰返しにおいてそれぞれ異なってもよく、 Y_{ye} は置換されていてもよいアミノ基または置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基を示し、 nye は1ないし10の整数を、 kye は0ないし3の整数を、 m_{ye} は1ないし8の整数を示す。)で表される縮合複素環カルボン酸誘導体またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平5-239024号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0110】49)式

【化137】



(式中、環 A_{yf} は置換基を有していてもよい芳香環を示し、 R_{1yf} は水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素残基を示すか、あるいは隣接する基-CH=C-および環 A_{yf} を構成する2個の炭素原子とともに置換されていてもよい炭素環を形成し、 R_{2yf} は水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素残基若しくはアシル基を示し、 R_{3yf} は置換基を有していてもよい炭化水素残基を示し、 nyf は2から6の整数を示す。)で表される不飽和カルボン酸アミド誘導体またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平2-138255号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。なお、上記の各種非カーバメート系アミン化合物は、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用

を有するので、殺虫作用も有する。

【0111】「排尿障害を引き起こす疾患を治療する薬剤」としては、前立腺肥大症の治療薬、前立腺癌の治療薬、膀胱頸部硬化症の治療薬、慢性膀胱炎の治療薬、便秘の治療薬、大腸癌の治療薬、子宮癌の治療薬、糖尿病の治療薬、脳血管障害の治療薬、脊髄損傷の治療薬、脊髄腫瘍の治療薬、多発性硬化症の治療薬、アルツハイマー病を含む痴呆症の治療薬、パーキンソン病の治療薬、進行性核上性麻痺の治療薬、ギラン-バレー症候群の治療薬、急性汎自律神経異常症の治療薬、オリブ橋小脳萎縮症の治療薬、頸椎症の治療薬などが挙げられる。

【0112】前立腺肥大症の治療薬としては、例えば、Allylestrenol、Chlormadinone acetate、Gestonorone caproate、Norgestrol、Mepartricin、Finasteride、P A-109、THE-320などが挙げられる。また、前立腺肥大に伴う排尿障害の治療薬として、YM-31758、YM-32906、KF-20405、MK-0434、フィナステリド、CS-891などの α -リダクターゼ阻害薬などが挙げられる。前立腺癌の治療薬としては、例えば、Ifosfamide、Estramustine phosphate sodium、Cyproterone、Chlormadinone acetate、Flutamide、Cisplatin、Londamine、Peplomycin、Leuprolerin、Finasteride、Triptorelin-DDS、Buserelin、Goserelin-DDS、Fenretinide、Bicalutamide、Vinorelbine、Nilutamide、Leuprolide-DDS、Deslorelin、Cetorelix、Ranpirnase、Leuprorelin-DDS、Satraplatin、Primomastat、Exisulind、Buserelin-DDS、Abarelix-DDSなどが挙げられる。膀胱頸部硬化症の治療薬としては、例えば、 α 1遮断剤などの α 遮断剤などが挙げられる。 α 遮断剤としては、例えば、タムスロシン (Tamsulosin)、プラゾシン (Prazosin)、テラゾシン (Terazosin)、ドキサゾシン (Doxazosin)、ウラピジル (Urapidil)、インドラミン (Indoramin)、アルフゾシン (Alfuzosin)、ダピプラゾール (Dapiprazole)、ナフトピジル (Naftopidil)、Ro 70-0004、KMD-3213、GYKI-16084、JTH-601、Z-350、Rec-15-2739、SK&F-86466、ブナゾシン (Bunazosin)、BMY-15037、ブフロメジル (Buflomedil)、ネルダゾシン (Neldazosin)、Moxisylyte、SL-890591、LY-23352、ABT-980、AIO-8507-L、L-783308、L-780945、SL-910893、GI-231818、SK&F-106686、RWJ-38063、セロドシン、フィドキシソシン (Fiduxosin)などが挙げられる。慢性膀胱炎の治療薬としては、例えば、Flavoxate hydrochlorideなどが挙げられる。便秘の治療薬としては、例えば、Sennoside A・B、Phenovalinなどが挙げられる。大腸癌の治療薬としては、例えば、Chromomycin A3、Fluorouracil、Tegafur、Krestinなどが挙げられる。子宮癌の治療薬としては、例えば、Chromomycin A3、Fluorouracil、Bleomycin hydrochlor

ide、Medroxyprogesterone acetateなどが挙げられる。

【0113】糖尿病の治療薬としては、例えばインスリン抵抗性改善薬、インスリン分泌促進薬、ビッグアニド剤、インスリン、 α -グルコシダーゼ阻害薬、 β 3アドレナリン受容体作動薬などが挙げられる。インスリン抵抗性改善薬としては、例えばビオグリタゾンまたはその塩（好ましくは塩酸塩）、トログリタゾン、ロシグリタゾンまたはその塩（好ましくはマレイン酸塩）、JTT-501、GI-262570、MCC-555、YM-440、DRF-2593、BM-13-1258、KRP-297、CS-011などが挙げられる。インスリン分泌促進薬としては、例えばスルフォニル尿素剤が挙げられる。該スルフォニル尿素剤の具体例としては、例えばトルブタミド、クロルプロバミド、トラザミド、アセトヘキサミド、グリクロピラミドおよびそのアンモニウム塩、グリベンクラミド、グリクラジド、グリメピリドなどが挙げられる。上記以外にも、インスリン分泌促進剤としては、例えばレバグリニド、ナテグリニド、KAD-1229、JTT-608などが挙げられる。ビッグアニド剤としては、例えばメトホルミン、ブホルミンなどが挙げられる。インスリンとしては、例えばウシ、ブタの膵臓から抽出された動物インスリン；ブタの膵臓から抽出されたインスリンから酵素的に合成された半合成ヒトインスリン；大腸菌、イーストを用い遺伝子工学的に合成したヒトインスリンなどが挙げられる。インスリンとしては、0.45から0.9 (w/w) %の亜鉛を含むインスリン亜鉛；塩化亜鉛、硫酸プロタミンおよびインスリンから製造されるプロタミンインスリン亜鉛なども用いられる。さらに、インスリンは、そのフラグメントあるいは誘導体（例、INS-1など）であってもよい。 α -グルコシダーゼ阻害薬としては、例えばアカルボース、ボグリボース、ミグリトール、エミグリテートなどが挙げられる。 β 3アドレナリン受容体作動薬としては、例えばAJ-9677、BMS-196085、SB-226552、SR-58611-A、CP-114271、L-755507などが挙げられる。上記以外にも、糖尿病治療薬としては、例えばエルゴセット、プラムリントイド、レプチン、BA Y-27-9955などが挙げられる。などが挙げられる。

【0114】脳血管障害の治療薬としては、例えば、Nicaraven、Bencyclane fumarate、Eurnamonine、Flunarizine、Nilvadipine、Ibudilast、Argatroban、Nizofenone、Naftidrofuryl、Nicergoline、Nimodipine、Papaveroline、Alteplase、Viquidil hydrochloride、Moxisylyte、Pentoxifylline、Dihydroergotamine mesylate、Lemildipine、Cyclandelate、Xanthinol nicotinate、Febarbamate、Cinnarizine、Memantine、Ifenprodil、Meclofenoxate hydrochloride、Ebselen、Clopidogrel、Nebracetam、Edaravone、Clinprost-DDS、Vatanidipine、Ancrod、Dipyridamoleなどが挙げられる。脊髄損

傷の治療薬としては、例えば、Methylprednisolone、Dural graft matrixなどが挙げられる。脊髄腫瘍の治療薬としては、例えば、Nimustine hydrochlorideなどが挙げられる。多発性硬化症の治療薬としては、例えば、Interferon- β -1bなどが挙げられる。

【0115】アルツハイマー病を含む痴呆症の治療薬としては、例えば、Aniracetam、Arginine pyroglutamate、Nefiracetam、Nimodipine、Piracetam、Propentofylline、Vinpocetine、Indeloxazine、Vitamin E、Cinepazide、Memantine、Lisuride hydrogen malate、Pramiracetam、Zuclopenthixol、Protirelin、EGB-761、Acetyl-L-carnitine、Phosphatidylserine、Nebracetam、Taltireline、Choline alphoscerate、Ipidacrine、Talsacilidine、Cerebrolysin、Rofecoxib、ST-618、T-588、Tacraine、Physostigmine-DDS、Huperzine A、Donepezil、Rivastigmine、Metrifonate、TAK-147などが挙げられる。パーキンソン病の治療薬としては、例えば、Taliexole、Amantadine、Pergolide、Bromocriptine、Selegiline、Mazaticol hydrochloride、Memantine、Lisuride hydrogen malate、Trihexyphenidyl、Piroheptin hydrochloride、Terguride、Ropinirole、Ganglioside-GM1、Droxidopa、Riluzole、Gabergoline、Entacapone、Rasagiline、Pramipexole、L-dopa-methylester、Tolcapone、Remacemide、Dihydroergocryptine、Carbidopa、Selegiline-DDS、Apomorphine、Apomorphine-DDS、Etilevodopa、Levodopaなどが挙げられる。進行性核上性麻痺の治療薬としては、例えば、L-ドーパ（L-dopa）、カルビドパ（carbidopa）、ブロモクリプチン（bromocriptine）、ベルゴリド（pergolide）、リスリド（lisuride）、アミトリプチリン（amitriptyline）などが挙げられる。ギラン・バレー症候群の治療薬としては、例えば、ステロイド剤やプロチレリン（protireline）などのTRH製剤などが挙げられる。急性汎自律神経異常症の治療薬としては、例えば、ステロイド剤、ドロキシドパ（L-threo-DOPS）、ジヒドロエルゴタミン（dihydroergotamine）、アメジニウム（amezinium）などが挙げられる。オリブ橋小脳萎縮症の治療薬としては、例えば、TRH製剤、ステロイド剤あるいはミドドリン（midodrine）、アメジニウム（amezinium）などが挙げられる。頸椎症の治療薬としては、例えば、消炎鎮静薬などが挙げられる。

【0116】「他の疾患治療のために投与されるがそれ自体が排尿障害を惹起する薬剤」としては、例えば、鎮痛薬（モルヒネ、塩酸トラマドールなど）、中枢性骨格筋弛緩薬（バクロフェンなど）、ブチロフェノン系抗精神病薬（ハロペリドールなど）、頻尿・尿失禁治療薬（塩酸オキシブチニン、塩酸アロピベリン、トルテロジン、グリフェナシン、YM-905/YM-537、テミベリン（NS-21）、KRP-197、トロスピウムなどのムスカリン拮抗薬；塩酸フラボキサートなどの平滑筋弛緩薬；NC-1800など

の筋弛緩薬；クレンブトールなどのBeta2 アゴニスト；ZD-0947、NS-8、KW-7158、WAY-151616などのカリウムチャンネル開口薬；ONO-8711などのPGE2 アンタゴニスト；レジニフェラトキシシ、カプサイシンなどのパニロイド受容体アゴニスト；TAK-637、SR-48968 (saredutan)、SB-223412 (talnerant) などのタキキニン拮抗薬；デルタオピオイドアゴニストなど）、鎮痙薬（臭化ブチルスコポラミン、臭化ブトロピウム、臭化チキジウム、臭化チメピジウム、臭化プロバンテリンなど）、消化管潰瘍治療薬（コランチル、メサフィリン、シメチジンなど）、パーキンソン病治療薬（塩酸トリヘキシフェニジル、ビペリデン、塩酸マザチコール、レボドパなど）、抗ヒスタミン薬（ジフェンヒドラミン、マレイン酸クロルフェニラミン、塩酸ホモクロルシクリジンなど）、三環系抗うつ薬（塩酸イミプラミン、塩酸アミトリプタリン、塩酸クロミプラミン、アモキサピン、塩酸デシプラミンなど）、フェノチアジン系抗精神病薬（クロルプロマジン、プロペリシアジン、レボメプロマジン、チオリダジンなど）、ベンゾジアゼピン系精神安定薬・睡眠鎮静薬（ジアゼパム、クロルジアゼポキシド、クロチアゼパム、エスタゾラムなど）、抗不整脈薬（ジソピラミドなど）、血管拡張薬（塩酸ヒドララジンなど）、脳末梢循環改善薬（ペントキシフィリンなど）、気管支拡張薬（テオフィリン、塩酸エフェドリン、塩酸メチルエフェドリンなど）、 β -アドレナリン遮断薬（塩酸プロプラノロールなど）、感冒薬（ダンリッチなど）、末梢性骨格筋弛緩薬（ダントロレンナトリウムなど）、抗結核薬（イソニアジドなど）などが挙げられる。これらの組み合わせのうち、8-[3-[1-[3-フルオロフェニル]メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶とタムスロシン (Tamsulosin)、プラゾシン (Prazosin) などの α 遮断剤との組み合わせが好ましい。

【0117】非カルバメート系アミン化合物またはその塩と、排尿障害を引き起こす疾患を治療する薬剤もしくは排尿障害を惹起する薬剤とを併用して用いる場合、例えば（１）公知の製剤学的製造法に準じ、所望により適宜製剤学的に許容され得る賦形剤等と共に単一剤に製造する、（２）それぞれを所望により製剤学的に許容され得る賦形剤等を用いて各製剤とし同時または時差を設けて組み合わせて使用（併用）する、または（３）それぞれを常法により適宜賦形剤と共にそれぞれ製剤化したものをセット（キット剤等）等としてもよい。（２）の場合、本発明の目的が達成される限り、各製剤の投与回数とは異なってもよい。このような製剤中の有効成分の含有量は、各々の有効成分の有効量の範囲内あるいは製剤学的、薬理学的に許容される範囲内であればよい。具体的には通常約0.01～約100重量%である。

【0118】（８）投与量

本発明の結晶および本発明の医薬組成物の投与量は、投与対象、投与ルート、疾患等により異なるが、例えば、排尿困難治療剤として、成人（体重約60kg）に対して、経口剤として、1回当たり有効成分として約0.05～100mg、好ましくは約0.05～30mg、さらに好ましくは約0.2～10mgであり、1日1回の投与でもよいし、数回に分けて投与することもできる。薬物を組み合わせて用いる場合には、個々の薬物の最少推奨臨床投与量を基準とし、投与対象、投与対象の年齢および体重、症状、投与時間、投与方法、剤型、薬物の組み合わせなどにより、適宜選択することができる。ある特定の患者の投与量は、年齢、体重、一般的健康状態、性別、食事、投与時間、投与方法、排泄速度、薬物の組み合わせ、患者のその時に治療を行っている病状の程度に依り、それらあるいはその他の要因を考慮して決められる。典型的には、非カルバメート系アミン化合物またはその塩と、各種疾患治療薬から選ばれる少なくとも一種の化合物またはその塩との組み合わせに関する個々の一日投与量は、それらが単独で投与される場合の実態に関して最少推奨臨床投与量の約1/50以上最大推奨レベル以下の範囲である。

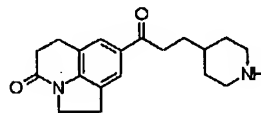
【0119】

【発明の実施の形態】以下に、参考例、実施例、製剤例および試験例を挙げて本発明をさらに詳細に説明するが、本発明はこれらにより限定されるものではない。また、以下の参考例および実施例において、%は特記しない限り重量パーセントを示す。融点はデュッヒ社製535型融点測定装置およびヤナコ機器開発研究所（株）社製MP-500Dを用いて測定した。粉末X線結晶回折のデータは、線源としてCu-K α 1線を用い、RINT1100型（理学電気（株））を用いて測定した。

【0120】

【実施例】参考例1

8-[3-(4-ビペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン
【化138】



1) 3-(1-アセチル-4-ビペリジニル)プロピオン酸 (8.2g, 0.443mol) を、氷冷下、塩化チオニル(300ml)に少量ずつ加えた。室温で10分間攪拌後、減圧下、25°Cにて塩化チオニルを留去した。残渣にジエチルエーテルを加え、減圧留去して黄色固形物を得た。さらにジエチルエーテルを加え、固形物をスパーテルで粉碎し、減圧留去して、3-(1-アセチル-4-ビペリジニル)プロピオン酸クロリドの粗生成物を淡黄色粉末として得た。この淡黄色粉末および1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(64.0g, 0.369mol)を1,2-ジクロ

ロエタン(200mL)に懸濁し、塩化アルミニウム(162g, 1.21mol)を室温で少量ずつ加えた。室温で12時間撹拌した後、反応混合物を氷-水に加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、淡黄色油状物を得た。油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: 酢酸エチル-メタノール=9:1)で精製し、エタノール-ジエチルエーテルから結晶化させることにより、8-[3-(1-アセチル-4-ビペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン 123.5gを融点 157-159°Cの無色結晶として得た。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.00-1.30 (2H, m), 1.50-1.95 (5H, m), 2.09 (3H, s), 2.53 (1H, dt, J=12.9, 2.4 Hz), 2.72 (2H, t, J=7.6 Hz), 2.90-3.15 (5H, m), 3.24 (2H, t, J=8.6 Hz), 3.75-3.90 (1H, m), 4.14 (2H, t, J=8.6 Hz), 4.55-4.70 (1H, m), 7.68 (1H, s), 7.73 (1H, s)。

元素分析 C₂₁H₂₆N₂O₃ として

計算値: C, 71.16; H, 7.39; N, 7.90。

実験値: C, 71.12; H, 7.18; N, 7.80。

2) 1) で得た8-[3-(1-アセチル-4-ビペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(118.7g, 0.335mol)に濃塩酸(600 mL)を加え、140°Cで4時間撹拌した。室温まで冷却後、減圧下にて塩酸を留去し、得られた残渣を8規定水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性(pH>12)とし、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去し、酢酸エチル-ジエチルエーテルから結晶化させることにより、表題化合物 103.7gを融点 114-115°Cの無色結晶として得た。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.00-1.30 (2H, m), 1.30-1.90 (7H, m), 2.59 (2H, dt, J=12.0, 2.4 Hz), 2.72 (2H, t, J=7.6 Hz), 2.85-3.15 (5H, m), 3.23 (2H, t, J=8.6 Hz), 4.14 (2H, t, J=8.6 Hz), 7.68 (1H, s), 7.73 (1H, s)。

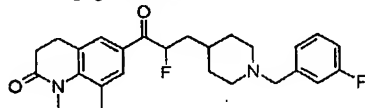
元素分析 C₁₉H₂₄N₂O₂ として

計算値: C, 73.05; H, 7.74; N, 8.97。

実験値: C, 72.96; H, 7.48; N, 9.15。

【0121】参考例2

8-[2-フルオロ-3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン



窒素置換した三つ又フラスコに、1,1,1,3,3,3-ヘキサメ

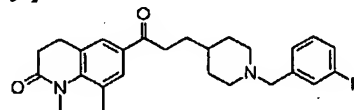
チルジシラザン(1.38g, 8.60mmol)のTHF(50mL)溶液を入れ、ドライアイス-アセトンバスにて冷却した。n-BuLiのヘキサン溶液(1.6M)(5.4mL, 8.6mmol)を滴下した後、溶液を-20°Cで10分間撹拌した。再びドライアイス-アセトンバスに移し、実施例1で得た8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(3.0g, 7.1mmol)のテトラヒドロフラン(20 mL)溶液を滴下し、-20°Cで20分間撹拌した。再びドライアイス-アセトンバスに移し、N-フルオロベンゼンスルホンイミド(1.38g, 8.6mmol)のテトラヒドロフラン(20mL)溶液を滴下し、室温まで自然昇温させた。反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(展開溶媒: 酢酸エチル)にて精製することにより、表題化合物を無色油状物(42mg)として得た。

¹H NMR (300MHz, CDCl₃) δ 1.20-1.40 (3H, m), 1.60-1.80 (4H, m), 1.85-2.00 (2H, m), 2.80-2.95 (2H, m), 2.93 (2H, t, J=7.5Hz), 3.25-3.45 (4H, m), 3.47 (2H, s), 4.18 (2H, t, J=8.7Hz), 5.21 (1H, dt, J=46.5, 6.6Hz), 6.90-7.10 (3H, m), 7.20-7.30 (1H, m), 7.73 (1H, s), 7.76 (1H, s)。

【0122】実施例1

8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン

【化139】



参考例1で得た8-[3-(4-ビペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(103.7g, 0.332mol)のアセトニトリル(750mL)溶液に、3-フルオロベンジルブロミド(65.9g, 0.349mol)および無水炭酸カリウム(80g)を加え、室温で12時間撹拌した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチル(250mL)-テトラヒドロフラン(250mL)-水(200mL)混合溶液に加え、有機層を分離した。水層を酢酸エチル(80mL)-テトラヒドロフラン(50mL)で2回抽出した。有機層をまとめ、飽和食塩水(150mL)で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮して無色の粗結晶(130.6g)を得た。粗結晶の半分の量を約40°Cに温めながら酢酸エチル(140mL)-メタノール(10mL)-クロロホルム(150mL)に溶解し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(シリカゲル: 300g, 展開溶媒: 酢酸エチル-メタノール=10:1)で精製した。同一の工程を繰り返

して、合計115.4gの粗結晶を得た。得られた結晶115.4gにエタノール(500mL)を加え、攪拌しながら均一な溶液になるまで加熱還流した。常圧下に加熱しながらエタノール(約250mL)を留去した後、加熱を止め、自然冷却させながら6時間攪拌した。析出した結晶を濾取し、冷エタノール(250mL)で洗浄後、室温で乾燥して、表題化合物111.3gを融点114-117℃の無色結晶として得た。粉末X線結晶回折パターンを図1に示す。

¹H NMR (CDCl₃) δ: 1.20-1.50 (4H, m), 1.55-1.80 (4H, m), 1.85-2.05 (2H, m), 2.71 (2H, t, J=7.6 Hz), 2.80-3.15 (5H, m), 3.22 (2H, t, J=8.6 Hz), 3.47 (2H, s), 4.13 (2H, t, J=8.6 Hz), 6.85-7.15 (3H, m), 7.20-7.35 (1H, m), 7.67 (1H, s), 7.72 (1H, s).

元素分析値: C₂₆H₂₉FN₂O₂として

計算値: C, 74.26; H, 6.95; N, 6.66.

実験値: C, 74.28; H, 7.02; N, 6.58.

【0123】粉末X線結晶回折のデータ

回折角: 2θ (°) 面間隔: d値 (Å)

5.08	17.4
10.2	8.68
16.8	5.27
17.8	4.97
18.6	4.76
20.6	4.31
23.1	3.85

【0124】製剤例1

(1) 実施例1の結晶 1g
(2) 乳糖 197g
(3) トウモロコシ澱粉 50g
(4) ステアリン酸マグネシウム 2g
上記(1)、(2)およびトウモロコシ澱粉(20g)を混和し、トウモロコシ澱粉(15g)と25mLの水から作ったペーストとともに顆粒化し、これにトウモロコシ澱粉(15g)と上記(4)を加え、混合物を圧縮錠剤機で圧縮して、錠剤1錠当たり実施例1の結晶を0.5mg含有する直径3mmの錠剤2000個を製造した。

【0125】製剤例2

(1) 実施例1の結晶 2g
(2) 乳糖 197g
(3) トウモロコシ澱粉 50g
(4) ステアリン酸マグネシウム 2g
製剤例1と同様の方法により、錠剤1錠当たり実施例1の結晶を1.0mg含有する直径3mmの錠剤2000個を製造した。

【0126】製剤例3

(1) 実施例1の結晶 5.0mg
(2) 乳糖 60.0mg

保存期間(日)

* (3) トウモロコシ澱粉 35.0mg
(4) ゼラチン 3.0mg
(5) ステアリン酸マグネシウム 2.0mg
上記(1)、(2)および(3)の混合物を10%ゼラチン水溶液0.03mL(ゼラチンとして3.0mg)を用い、1mmメッシュの篩を通して顆粒化した後、40℃で乾燥した後、再び篩過した。得られた顆粒を上記(5)と混合し、圧縮した。得られた中心錠を蔗糖、二酸化チタン、タルクおよびアラビアガムの水懸液による糖衣でコーティングした。コーティングが施された錠剤をミツロウで艶出してコート錠を得た。

【0127】実験例1

アセチルコリンエステラーゼ阻害活性の測定

実施例1の結晶のアセチルコリンエステラーゼ阻害活性の測定を、ヒト赤血球由来アセチルコリンエステラーゼを用いて、アセチルチオコリン法(Ellman法)にて行った。ヒト赤血球由来のアセチルコリンエステラーゼ(Sigma社)を蒸留水にて0.2 IU/mLの濃度に溶解し酵素標品とした。96wellマイクロプレートに薬液200μL、80mM Tris-HCl (pH 7.4) 30μL、酵素標品50μLおよび5mM 5,5-dithio-bis(2-nitrobenzoic acid) (Sigma社) 50μLを分注し、10秒間振とうした。50μLの4mM acetylthiocholin iodide (Sigma社)を添加し、再度振とうした直後から10分間30秒間隔で414nmにおける吸光増加を測定した。次式により酵素活性を測定した。

$R = 5.74 \times 10^{-7} \times \Delta A$

(式中、Rは酵素活性(mol)、ΔAは414nmの吸光増加を示す)

30 各化合物について少なくとも3回実験を繰り返し、50%阻害濃度(IC₅₀)を求めた。また、上記方法と同様にして、ジスチグミンのアセチルコリンエステラーゼ阻害活性を測定した。結果を下表に示す。

【0128】

化合物 IC₅₀ (nM)

実施例1 6.6

ジスチグミン 651.9

上記の結果より、本発明の結晶は優れたアセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有することがわかる。

40 【0129】実験例2

吸湿性試験

実施例1の結晶0.3gを秤量瓶に量り、25℃で相対湿度(RH)75%(塩化ナトリウムの飽和溶液)およびRH93%(硝酸カリウムの飽和溶液)のデシケータ中で開栓して14日間保存し、その重量変化率を調べた。結果を下表に示す。

【0130】

重量変化率(%)

25℃/75%RH 25℃/93%RH

93

94

4	+ 0.11	+ 0.06
7	+ 0.11	+ 0.09
14	+ 0.18	+ 0.15

上記の結果より、本発明の結晶は重量変化がほとんどなく吸湿性が認められないことがわかる。また、各試料の粉末X線解析像はいずれも保存前と同様であり、結晶形の変化は認められなかった。

【0131】実験例3

安定性試験

実施例1の結晶を、以下の各条件下で保存した試料の性状、残存率を調べた。

保存条件	性状	残存率(%)
1 (60℃/3ヶ月)	白色結晶	99.8
2 (40℃/75%RH, 気密)	白色結晶	101.6
3 (40℃/75%RH, 開栓)	白色結晶	100.2
4 (キセノンランプ/20時間)	白色結晶	100.1

上記の結果より、本発明の結晶は性状の変化、残存率の低下は認められず、安定であることがわかる。また、粉末X線解析像はいずれも保存前と同様であり、結晶形の変化は認められなかった。

【0133】

【発明の効果】本発明の結晶は、優れたアセチルコリンエステラーゼ阻害作用、膀胱排出力改善作用を有し、毒※

* 保存条件：1. 60℃で3ヶ月間（褐色ガラス瓶、気密）；2. 40℃、相対湿度75%で3ヶ月間（褐色ガラス瓶、気密）；3. 40℃、相対湿度75%で3ヶ月間（褐色ガラス瓶、開栓）；4. キセノンランプ下（6万ルクス）で20時間（120万ルクス・h）（ポリ塩化ビニリデン製フィルムで覆ったシャーレ）

結果を下表に示す。

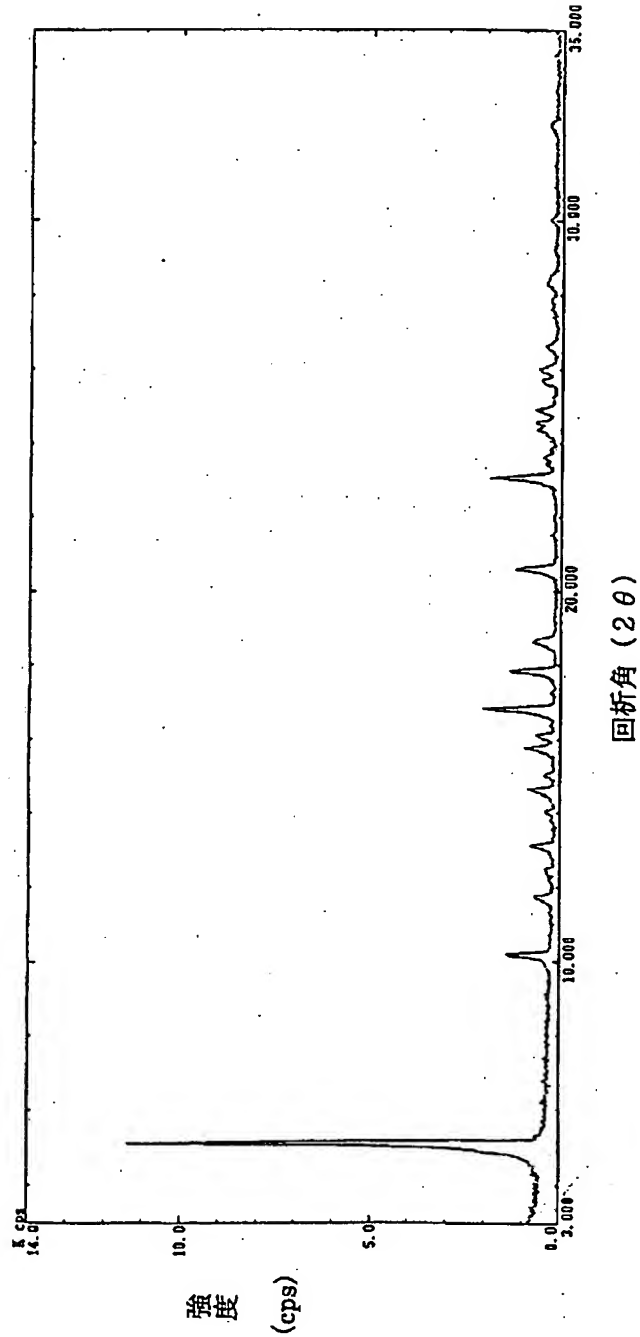
* 【0132】

※性は低く、医薬品として有用である。また、本発明の結晶は、高純度、高品質であり、吸湿性が低く、通常条件下で長期間保存しても変質せず、安定性に極めて優れている。

【図面の簡単な説明】

【図1】実施例1で得られた結晶の粉末X線結晶回折パターンを示す。

【図1】



フロントページの続き

(51)Int. Cl.⁷

A 6 1 P 25/28
43/00

識別記号

1 1 1

F I

A 6 1 P 25/28
43/00

テ-マ-コ-ト' (参考)

1 1 1

F ターム(参考) 4C065 AA07 BB04 CC09 DD01 EE02

HH01 JJ04 KK04 PP03 PP08

PP13

4C084 AA19 NA03 NA11 ZA152

ZA812 ZA832 ZA842 ZC202

ZC422 ZC752

4C086 AA01 AA03 CB05 GA15 MA01

MA02 MA04 NA03 NA11 ZA15

ZA81 ZA83 ZA84 ZC20 ZC42

ZC75

Disclaimer:

This English translation is produced by machine translation and may contain errors. The JPO, the INPIT, and those who drafted this document in the original language are not responsible for the result of the translation.

Notes:

1. Untranslatable words are replaced with asterisks (****).
2. Texts in the figures are not translated and shown as it is.

Translated: 05:20:04 JST 08/23/2007

Dictionary: Last updated 07/20/2007 / Priority:

[Document Name] Request for a Patent

[Serial Number] 176829

[Filing Date] Heisei 13(2001) March 23

[Recipient] Commissioner of the Patent Office

[International Patent Classification] A61K 31/13

[Inventor(s)]

[Address] 3-3-8, Yamada, Itami-shi, Hyogo-ken

[Name] ISHIHARA, Yuji

[Inventor(s)]

[Address] 1-10-25, Tsuruyamadai, Izumi-shi, Osaka

[Name] Doi Dutiful

[Inventor(s)]

[Address] 1-1-210, Taisho-cho, Ibaraki-shi, Osaka

[Name] ISHICHI, Yuji

[An Applicant]

[Identification Number] 000002934

[Address] 4-1-1, Doshomachi, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka

[Name] TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES LTD.

[Attorney]

[Identification Number] 100062144

[Patent Attorney]

[Name] AOYAMA, Tamotsu

[The representative who assigned]

[Identification Number] 100081422

[Patent Attorney]

[Name] TANAKA, Mitsuo

[The claim of priority based on an earlier application]

[Application number] Application for patent 2000-88523

[Filing date] Heisei 12(2000) March 24.

[A display of a commission]

[A prepayment ledger number] 013262

[A money paid frame] 21,000 yen

[The list of a paper affair]

[A housing name] Description 1

[A housing name] Drawings 1

[A housing name] Abstract 1

[A blanket letter-of-attorney number] 9701338

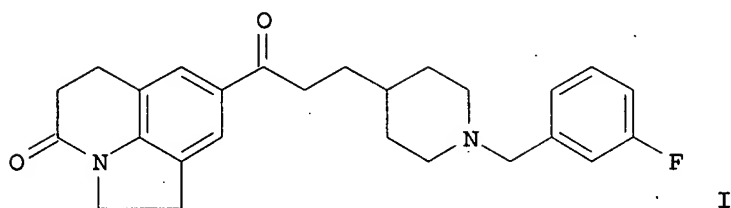
[Necessity of a proof] Important point

[Translation done.]

L4 ANSWER 14 OF 15 CAPLUS COPYRIGHT 2007 ACS on STN
 ACCESSION NUMBER: 2001:873241 CAPLUS <<LOGINID::20070822>>
 DOCUMENT NUMBER: 136:15242
 TITLE: Crystals of condensed heterotricycle as
 acetylcholinesterase inhibitor and pharmaceutical
 compositions containing the crystals
 INVENTOR(S): Ishihara, Yuji; Doi, Takayuki; Ishiji, Yuji
 PATENT ASSIGNEE(S): Takeda Chemical Industries, Ltd., Japan
 SOURCE: Jpn. Kokai Tokkyo Koho, 50 pp.
 CODEN: JKXXAF
 DOCUMENT TYPE: Patent
 LANGUAGE: Japanese
 FAMILY ACC. NUM. COUNT: 3
 PATENT INFORMATION:

PATENT NO.	KIND	DATE	APPLICATION NO.	DATE
JP 2001335576	A	20011204	JP 2001-85190	20010323
US 2002177593	A1	20021128	US 2001-960477	20010924
US 2006281725	A1	20061214	US 2006-475881	20060628
PRIORITY APPLN. INFO.:			JP 2000-88523	A 20000324
			JP 1998-276677	A 19980930
			WO 1999-JP5367	W 19990930
			US 2001-787288	A2 20010315
			JP 2001-85190	A 20010323
			US 2001-960477	A1 20010924

GI



AB Crystals of 8-[3-[1-[(3-fluorophenyl)methyl]-4-piperidinyl]-1-oxopropyl]-1,2,5,6-tetrahydro-4H-pyrrolo[3,2,1-ij]quinolin-4-one (I) or its salts, preferably having m.p. 113-118°, and pharmaceutical compns. containing the crystals are claimed. The compns. are useful for treatment of dysuria by increasing force of bladder emptying. The crystals may be used in combination with α -blockers. Thus, crude crystal of I (preparation given) was dissolved in AcOEt/MeOH/CHCl₃ and the solution was subjected to silica gel chromatog. After repeating the process, the crystal was dissolved in EtOH and the solution was heated to remove EtOH and cooled under stirring for 6 h to give I having m.p. 114-117°.

Disclaimer:

This English translation is produced by machine translation and may contain errors. The JPO, the INPIT, and those who drafted this document in the original language are not responsible for the result of the translation.

Notes:

1. Untranslatable words are replaced with asterisks (****).
2. Texts in the figures are not translated and shown as it is.

Translated: 05:05:58 JST 08/23/2007

Dictionary: Last updated 07/20/2007 / Priority:

[Document Name] Description

[Title of the Invention] The crystal of a tricyclic condensation heterocyclic derivative

[Claim(s)]

[Claim 1] 8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidiny]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, and 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON or the crystal of the salt.

[Claim 2] The crystal according to claim 1 whose melting point is 110 degrees C or more.

[Claim 3] The crystal according to claim 1 whose melting points are about 113 degrees C - about 118 degrees C.

[Claim 4] The medicine constituent containing a crystal according to claim 1.

[Claim 5] The medicine constituent according to claim 4 which is acetylcholine esterase inhibitor.

[Claim 6] The medicine constituent according to claim 4 which is a bladder discharge power

improvement agent.

[Claim 7] The medicine constituent according to claim 4 which is a urination trouble medical treatment agent.

[Claim 8] The medicine constituent according to claim 4 which is a urination difficult medical treatment agent.

[Claim 9] [8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidiny]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, and 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON, or the crystal and alpha interception agent of the salt] The bladder discharge power improvement agent characterized by combining.

[Detailed Description of the Invention]

[0001]

[Field of the Invention] This invention relates to the crystal of a tricyclic condensation heterocyclic derivative which has acetylcholine esterase inhibitory action and a bladder discharge power improvement operation, and the medicine constituent containing the crystal.

[0002]

[Description of the Prior Art] [acetylcholine esterase inhibitory action] [the amorphous substance of 8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidiny]-1-OKISO pro pill]-1 which it has, 2 and 5, and 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON, or its salt] It is indicated to JP,H7-206854,A.

[0003]

[Problem to be solved by the invention] Absorbency is good on medicine industry and a crystal of stable acetylcholine esterase inhibitor, a bladder discharge power improvement agent, and a urination trouble and a urination difficult medical treatment agent is desired.

[0004]

[Means for solving problem] As a result of inquiring wholeheartedly, this invention persons are high purity and high quality, and hygroscopicity is low. Usually, even if saved under conditions for a long period of time, did not deteriorate, but excelled in stability extremely. It succeeded in obtaining the crystal of 8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidinyl]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, and 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON, and this invention was completed. This invention Namely, (1)8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidinyl]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, and 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON or the crystal of the salt, (2) The crystal of the above-mentioned (1) description whose melting point is 110 degrees C or more, the crystal of the above-mentioned (1) description whose (3) melting points are about 113 degrees C - about 118 degrees C, (4) The medicine constituent containing the crystal of the above-mentioned (1) description, the medicine constituent of the above-mentioned (4) description which is (5) acetylcholine-esterase inhibitor, (6) The medicine constituent of the above-mentioned (4) description which is a bladder discharge power improvement agent, the medicine constituent of the above-mentioned (4) description which is (7) urination-trouble medical treatment agent, (8) The medicine constituent of the above-mentioned (4) description which is a urination difficult medical treatment agent, (9) [8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidinyl]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, and 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON, or the crystal and alpha interception agent of the salt] It is related with the bladder discharge power improvement agent characterized by combining.

[0005] (1) The crystal of 8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidinyl]-1-OKISO pro pill]-1 of manufacturing process this invention, 2 and 5, and 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON (hereafter) also writing it as "the crystal of this invention" -- it is -- 8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidinyl]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, and 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON -- the very thing -- it can manufacture by crystallizing by a well-

known method. As the method of such crystallization, the crystallization from solution, the crystallization from steam, and the crystallization from a melting object are mentioned, for example. As the method of ** "crystallization from solution", the condensing method, a gradual cooling method, the reacting method (a diffusion method, the electrolyzing method), the hydrothermal raising method, a ** agent method, etc. are mentioned, for example. as the solvent used -- for example, aromatic hydrocarbon (an example and benzene --) halogenated hydrocarbon (an example and a methylene chloride --), such as toluene and xylene Saturated hydrocarbon (an example, HEKISAN, Cheb Than, cyclo HEKISAN, etc.), such as chloroform, ether (an example, diethylether, JIISO pro pill ether, and a tetrahydro franc --) nitril (an example, acetonitrile, etc.), such as JIOKISAN, and ketone (an example --) Sulfo KISHIDO, such as acetone, acid (example, dimethyl sulfoxide, etc.) amide (example, N, and N-JIMECHIRUHORUMU amide etc.), ester, alcohols (an example, ethyl acetate, etc.) (an example, methanol, ethanol, isopropyl alcohol, etc.), water, etc. are used. These solvents are mixed and used at a rate (an example, 1:1 to 1:100) independent or suitable in two or more sorts. As the method of ** "crystallization from steam", the evaporating method (the **** method, air current method), a gaseous-phase-reaction method, a chemical transport method, etc. are mentioned, for example. As the method of ** "crystallization from a melting object", the NORUMARU freezing method (the raising method, a temperature gradient method, Bridgman method), a belt fusion method (the zone leveling method, float zone method), the special growing-up method (the VLS method, liquid phase epitaxy method), etc. are mentioned, for example. As the analysis method of the obtained crystal, the method of the crystal analysis by an X diffraction is common. Furthermore, a mechanical method or an optical method is mentioned as a method of determining the direction of a crystal. The amorphous thing of 8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidinyl]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, and 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON or its salt is a well-known substance. For example, it can manufacture by the method according to the method or this which was written in the Description of JP,H7-206854;A. The crystal of this invention is obtained by applying this to the above-mentioned crystallizing method.

[0006] (2) as salt of salt 8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidinyl]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, and 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON The salt permitted in pharmacology is desirable, for example, salt with inorganic acid, salt with organic acid, etc. are mentioned. As a suitable example of salt with inorganic acid, salt with chloride, hydrobromic acid, nitric acid, sulfuric acid, phosphorus acid, etc. is mentioned, for example. As a suitable example of salt with organic acid, salt with Gyi acid, acetic acid, trifluoroacetic acid, fumaric acid, oxalic acid, tartaric acid, maleic acid, citrate, methanesulfonic acid, benzenesulfonic acid,

etc. is mentioned, for example.

[0007] (3) As a crystal of character this invention of a crystal, have the melting point of 110 degrees C or more, for example, and [with powder X-rays crystal diffraction] What shows the diffraction pattern which has a characteristic peak is mentioned to the field interval (d value) 17.4 [about], about 8.68, about 5.27, about 4.97, about 4.76, about 4.31, and about 3.85A. Preferably, it has the melting point (about 113 degrees C - about 118 degrees C), for example, and powder X-rays crystal diffraction shows the field interval (d value) 17.4 [about], about 8.68, about 5.27, about 4.97, about 4.76, about 4.31, and the diffraction pattern that has a characteristic peak in about 3.85A. the crystal of this invention -- high purity (99.9% of purity) -- even if it is quality, hygroscopicity is low and it usually saves under conditions for a long period of time, it does not deteriorate, but it excels in stability extremely.

[0008] (4) by mixing with the carrier which the crystal of prescription this invention has low toxicity, and can be permitted as it is or in pharmacology, and considering it as a medicine constituent It can use as a prevention / medical treatment agent of the various diseases mentioned later to mammals (an example, humans, a mouse, a rat, a rabbit, a dog, a cat, a cow, a horse, Buta, an ape, etc.). A diluent base [in / in here, various conventional organicity or an inorganic carrier substance is used as a tablet material as a carrier permitted in pharmacology, and / a solid tablet], a lubricant, a binding material, disintegrator; it is blended as the solvent in a liquefied tablet, a solubilizing agent, a suspending agent, an isotonicizing agent, a buffer, a soothing agent, etc. Moreover, tablet additives, such as an antiseptic, an anti-oxidizer, colorant, and a sweetener, can also be used if needed. As a suitable example of a diluent base, for example Milk sugar, white sugar, D-mannitol, D-sorbitol, starch, pregelatinization starch, dextrin, microcrystalline cellulose, Hydroxypropylcellulose, carboxymethylcellulose sodium, gum arabic, dextrin, a pull run, light anhydrous silicic acid, synthetic aluminum silicate, magnesium aluminometasilicate, etc. are mentioned. As a suitable example of a lubricant, stearic acid magnesium, calcium stearate, talc, colloid silica, etc. are mentioned, for example. As a suitable example of a binding material, for example Pregelatinization starch, sucrose, gelatin, Gum arabic, methyl cellulose, carboxymethyl cellulose, carboxymethylcellulose sodium, Microcrystalline cellulose, white sugar, D-mannitol, trehalose, dextrin, a pull run, hydroxypropylcellulose, hydroxypropyl methylcellulose, a poly vinyl pylori boss, etc. are mentioned. As a suitable example of disintegrator, for example Milk sugar, white sugar, starch, carboxymethyl cellulose, Carboxymethyl-cellulose calcium, crossing carmellose sodium, carboxymethyl starch sodium, light anhydrous silicic acid,

hydroxypropylcellulose, etc. are mentioned.

[0009] As a suitable example of a solvent, an injection solvent, a physiological salt solution, Ringer's solution, alcohol, propylene glycol, polyethylene glycols, sesame oil, corn oil, olive oil, cottonseed cake oil, etc. are mentioned, for example. As a suitable example of a solubilizing agent, for example Polyethylene glycols, propylene glycol, D-mannitol, trehalose, benzyl benzoate, ethanol, tris amino methane, cholesterol, triethanol amine, sodium carbonate, sodium acid citrate, salicylic acid sodium, acetic acid sodium, etc. are mentioned. As a suitable example of a suspending agent, for example Stearyl triethanol amine, Sodium lauryl sulfate, lauryl aminopropionic acid, lecithin, Surface-active agent, for example, polyvinyl alcohol, such as a benzalkonium chloride, a benzethonium chloride, and glyceryl monostearate, Hydrophilic polymers, such as a poly vinyl pyrrolidone, carboxymethylcellulose sodium, methyl cellulose, hydroxymethyl cellulose, hydroxyethyl cellulose, and hydroxypropylcellulose; poly SORUBETO, polyoxy ethylene hydrogenated castor oil, etc. are mentioned. As a suitable example of an isotonicizing agent, sodium chloride, glycerin, D-mannitol, D-sorbitol, grape sugar, etc. are mentioned, for example. As a suitable example of a buffer, buffer solution, such as an orthophosphate, acetate, carbonate, and citrate salt, etc. is mentioned, for example. As a suitable example of a soothing agent, benzyl alcohol etc. is mentioned, for example.

[0010] As a suitable example of an antiseptic, p-hydroxybenzoate esters, chloro butanol, benzyl alcohol, phenethyl alcohol, dehydroacetic acid, sorbic acid, etc. are mentioned, for example. As a suitable example of an anti-oxidizer, sulfite salt, ascorbic acid salt, etc. are mentioned, for example. As a suitable example of colorant, it is water-soluble edible tar dye ([an example and the edible red No. 2 reach and] No. 3), for example. Edible food colors, such as the edible yellow No. 4 and No. 5, the edible blue No. 1, and No. 2, water-insoluble natural lake pigments (an example, aluminum salt of the above-mentioned water-soluble edible tar dye, etc.), natural color (an example, beta-carotene, chlorophyll, red ocher, etc.), etc. are mentioned. As a suitable example of a sweetener, saccharin sodium, glycyrrhizin 2 potassium, aspartame, stevia, etc. are mentioned, for example.

[0011] (5) as the dosage forms of a medication form medicine constituent -- a tablet and a capsule agent (a soft capsule --) a microcapsule is included -- oral agent [, such as a granule, powder medicine, a syrup, an emulsion, and a suspension,]; and an injectable solution (an example --) parenterals, such as medicines for external application (an example, a pernasal

medication tablet, an endermic tablet, an ointment, etc.), such as a hypodermic injection agent, an intravenous injection agent, an injectable solution in muscles, and an intraperitoneal injection agent, ** agents (an example, a rectal suppository, a **** agent, etc.), a pellet, and an intravenous drip agent, are mentioned -- these -- respectively -- taking orally -- a medicine can be safely prescribed for the patient-like or parenterally. A medicine constituent can be manufactured in a tablet technical field by the conventional method, for example, a method given in the Pharmacopoeia of Japan etc. Below, the concrete manufacturing process of a tablet is explained in full detail.

[0012] An oral agent to an active ingredient, for example For example, a diluent base (an example, milk sugar, white sugar, starch, D-mannitol, etc.), disintegrator (an example, carboxymethyl-cellulose calcium, etc.) and a binding material (an example --) lubricants (an example --), such as pregelatinization starch, gum arabic, carboxymethyl cellulose, hydroxypropylcellulose, and a poly vinyl pylori boss talc, stearic acid magnesium, polyethylene glycols 6000, etc. -- etc. -- adding and carrying out compression molding and using a coating base for the purpose of masking of the taste, enteric, or durability as occasion demands subsequently -- the very thing -- it is manufactured by coating with a well-known method. As this coating base, a sugar-coating base, a water-soluble film coating base, an enteric film coating base, a sustained-release film coating base, etc. are mentioned, for example. As a sugar-coating base, white sugar is used and one sort chosen from talc, precipitated calcium carbonate, gelatin, gum arabic, a pull run, Kalna Barrow, etc. or two sorts or more may be further used together. As a water-soluble film coating base, for example Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropyl methylcellulose, hydroxyethyl cellulose, Cellulose system polymers, such as MECHIRU hydroxyethyl cellulose; Polyvinyl acetal diethylamino acetate, Synthetic polymers, such as an OIORAGITTOE (brand name) and aminoalkylmetaacrylatecopolymer E [loam FARUMA] poly vinyl pylori boss; polysaccharide, such as a pull run, etc. is mentioned. As an enteric film coating base, it is hydroxypropyl methylcellulose, for example. Phthalate, Hydroxypropyl methylcellulose Acetate succinate, Cellulose system polymers, such as carboxy methyl ethyl cellulose and cellulose acetate phthalate; Meta-acrylic acid copolymer L[OIORAGITTOL (brand name) Acrylic acid system polymers, such as loam FARUMA], the meta-acrylic acid copolymer LD [OIORAGITTO L-30D55 (brand name) and loam FARUMA], and meta-acrylic acid copolymer S [OIORAGITTOS (brand name) and loam FARUMA]; products of nature, such as shellac, etc. are mentioned. As a sustained-release film coating base, for example Cellulose system polymer; aminoalkylmetaacrylatecopolymer RS[OIORAGITTO RS (brand name), such as ethyl cellulose, Acrylic acid system polymers, such as loam FARUMA] and ethyl acrylate meta-

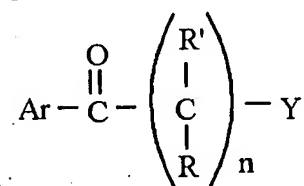
methyl acrylate copolymer soil suspension [OIDORAGITTO NE (brand name) and loam FARUMA], etc. are mentioned. You may mix and use the above-mentioned coating base at the rate proper in two or more sorts. Moreover, you may use shading agents, such as titanium oxide and 32 iron oxide, for example in the case of coating. An injectable solution an active ingredient A dispersing agent (an example, poly SORUBETO 80, polyoxy ethylene hydrogenated castor oil 60, etc.), Polyethylene glycols, carboxymethyl cellulose, sodium alginate, etc., A preservative (an example, MECHIRU paraben, pro pill paraben, benzyl alcohol, chloro butanol, phenol, etc.), isotonicizing agents (an example, sodium chloride, glycerin, D-mannitol, D-sorbitol, grape sugar, etc.) etc. -- a water solvent (an example --) It is manufactured by dissolving, ****(ing) or emulsifying to oily solvents (vegetable oil, such as an example, olive oil, sesame oil, cottonseed cake oil, and corn oil, propylene glycol, etc.); such as distilled water, a physiological salt solution, and Ringer's solution, etc. Under the present circumstances, you may use additives, such as solubilizing agents (an example, salicylic acid sodium, acetic acid sodium, etc.), stabilizer (an example, a human serum albumin, etc.), and soothing agents (an example, benzyl alcohol, etc.), by request.

[0013] (6) The crystal of disease this invention treated has acetylcholine esterase inhibitory action. Therefore, the crystal of this invention and the medicine constituent of this invention can be used as a prevention / medical treatment agent of golden age Alzheimer's disease. Moreover, the crystal of this invention and the medicine constituent of this invention can be used, for example as a bladder discharge power improvement agent. For example, it can use as the urination trouble which originates in 6 etc. from following 1, especially a prevention / medical treatment agent with difficult urination. 1) Prostatomegaly, 2 bladder cervix *****; three neuropathic bladders, four diabetes, five operations, a 6 low tensional bladder, and 7 Sjogren syndromes (dry eye, dry mouse, and vagina dryness etc.). The low strain bladder more specifically according to prostatic hypertrophy, the low strain bladder by diabetes, The low strain bladder by diabetic neuropathy, an idiopathic low strain bladder (what is depended on aging is included), The low strain bladder by multiple sclerosis, the low strain bladder by Parkinson's disease, The low strain bladder by cord injury, the low strain bladder after an operation, the low strain bladder by a brain block, It can use as a prevention / medical treatment agent with difficult urination by the neuropathic bladder by diabetes, the neuropathic bladder by diabetic neuropathy, the neuropathic bladder by multiple sclerosis, the neuropathic bladder by Parkinson's disease, the neuropathic bladder by cord injury, the neuropathic bladder by a brain block, etc. Furthermore, the crystal of this invention and the medicine constituent of this invention can be used also as a prevention / medical treatment agent of urination troubles, such as frequent urination and urinary incontinence.

[0014] (7) The crystal of combination use this invention with other ** is a kind of the non-Culver mate system amine compound which has acetylcholine esterase inhibitory action. The non-Culver mate system amine compounds which have acetylcholine esterase inhibitory action, including the crystal of this invention, Although a medicine is prescribed for the patient for the medicine which treats the disease which causes urination troubles (for example, urination difficulty etc.), or other disease medical treatment, itself can use combining the medicine with which urination troubles (for example, urination difficulty etc.) are caused. As such "a non-Culver mate system amine compound which has acetylcholine esterase inhibitory action" They are the first amine compound, the second amine compound, and the third amine compound preferably that what is necessary is just the compound which has acetylcholine esterase inhibitory action, and does not have the Culver mate structure (-OCON-) in a molecule, but replaced the hydrogen atom of ammonia by the hydrocarbon group. Furthermore, the compound of 1-49 which are indicated below etc. is listed preferably. The compound which has at least one 5 to 7 member nitrogen-containing heterocycle as a partial structure among these compounds is desirable, the below-mentioned compound of 1, 20, 23, 41, 42, and 43 etc. is desirable, and especially the compound of 1 etc. is especially desirable.

[0015] 1) Formula

[Chemical formula 1]



Ar is the phenyl group which may be condensed among [type, and this phenyl group may have a substituent. The hydrocarbon group in which, as for n, integer, R, and R' of 1 to 10 may have a hydrogen atom, a halogen atom, or a substituent, respectively, and Y show the nitrogen-containing saturation heterocyclic machine which may have the amino group which may have a substituent, or a substituent. The compound (it may be hereafter written as a compound (I)) expressed with], or its salt.

[0016] As a "substituent" of "this phenyl group may have a substituent by the phenyl group

which may be condensed" shown by Ar among the above-mentioned formula For example, low-grade alkyl-group and (ii) halogen atom by which (i) halogenation may be carried out A (fluoro, Krol, Blom, iodine, etc.) low-grade (iii) alkylene dioxy machine [for example,] (For example, C1-3 alkylene dioxy machines, such as methylene dioxy and ethylene dioxy) etc., (iv) A nitro group, the (v) cyano group, the (vi) hydroxy group, the lower alkoxy group that may be halogenated (vii), (viii) a cycloalkyl machine (for example, a cyclo pro pill and cyclo butyl --) C3-6 cycloalkyl machines, such as cyclopentyl and cyclohexyl etc., (ix) The low-grade ARUKIRUCHIO machine, the (x) amino group which may be halogenated, (xi) a Monod low-grade alkylamino machine (for example, methylamino and ethylamino --) G (xii) low-grade alkylamino machines (for example, G C1-6 alkylamino machines, such as dimethylamino and diethylamino etc.), such as Monod C1-6 alkylamino machines, such as propylamino, 5 (xiii), or a 7 membered-ring-like amino group (for example, except for one nitrogen atom -- a nitrogen atom --) 5 which may have 1 to 3 hetero atoms chosen from an oxygen atom, a sulfur atom, etc., or a 7 membered-ring-like amino group (an example --) pyrrolidino, piperidino, piperazino, morpholino, thiomorpholino, etc. -- etc. -- (xiv) a low-grade Al ****- carbonylamino machine (for example, acetylamino --) Propionylamino, the C1-6 Al ****- carbonylamino machine of BUCHIRIRU amino **, etc., (xv) a low-grade ARUKIRU sulfonylamino machine (for example, methylsulfonylamino --) C1-6 ARUKIRU sulfonylamino machines, such as ethyl sulfonylamino and pro pill sulfonylamino etc., (xvi) Low-grade alkoxy carbonyl group (for example, [METOKISHIKARUBONIRU and]) C1-6 alkoxy carbonyl groups, such as ethoxycarbonyl, propoxy KARUBONIRU, and iso butoxycarbonyl etc., (xvii) A KARUBOKISHI machine, a low-grade (xviii) Al ****- carbonyl group (for example, C1-6 Al ****- carbonyl groups, such as MECHIRUKARUBONIRU, ethyl KARUBONIRU, and butyl KARUBONIRU) etc. and cycloalkyl (xix) carbonyl groups (for example, cyclo propylcarbonyl -- [, and]) [cyclo butyl] [cyclo pen chilca] C3-6 cycloalkyl carbonyl groups, such as cyclohexyl KARUBONIRU etc., (xx) A carbamoyl group, a CHIOKARUBAMOIRU machine, a Monod (xxi) low-grade Al ****- carbamoyl group for example, methylcarbamoyl -- [, and] [ethyl] [pro pill] G low-grade Al ****- carbamoyl groups, such as Monod C1-6 Al ****- carbamoyl groups (xxii), such as butylcarbamoyl, (-- for example, diethylcarbamoyl and a jib -- G C1-6 Al ****- carbamoyl groups, such as chilca RUBAMOIRU, etc. --) -- (xxiii) a low-grade ARUKIRU sulfonyl group (for example, methylsulfonyl --) C1-6 ARUKIRU sulfonyl groups, such as ethyl sulfo nil and pro pill sulfo nil etc., (xxiv) a cycloalkyl sulfonyl group (for example, cyclopentyl sulfo nil --) C3-6 cycloalkyl sulfo nil, such as cyclohexyl sulfo nil etc., (xxv) A phenyl group, the Naff (xxvi) Chill machine, ****- (xxvii) phenyl low-grade alkyl groups (for example, ****- phenyl C1-6 alkyl groups, such as Ben Jill and phenylethyl etc.), a G (xxviii) phenyl low-grade alkyl group (for example, [and]) [diphenyl] ****- (xxix) phenyl low-grade Al ****- carbonyloxy group (for example, phenylmethyl carbonyloxy --), such as G phenyl C1-6 alkyl groups, such as

diphenylethyl ****- phenyl C1-6 Al ****- carbonyloxy group, such as phenylethyl carbonyloxy etc., (xxx) G phenyl low-grade Al ****- carbonyloxy group (For example, G phenyl C1-6 Al ****- carbonyloxy group, such as diphenyl MECHIRU carbonyloxy and diphenylethyl carbonyloxy) etc., (xxxi) A phenoxy group, a ****- (xxxii) phenyl low-grade Al ****- carbonyl group (for example, [and]) [phenylmethyl] ****- phenyl C1-6 Al ****- carbonyl groups, such as phenylethyl KARUBONIRU etc., (xxxiii) A G phenyl low-grade Al ****- carbonyl group (For example, G phenyl C1-6 Al ****- carbonyl groups, such as diphenyl MECHIRUKARUBONIRU and diphenylethyl KARUBONIRU) etc., (xxxiv) a benzoyl group, a FENOKISHI (xxxv) carbonyl group, and a phenyl (xxxvi) low-grade Al ****- carbamoyl group (for example, phenyl methylcarbamoyl --) Phenyl C1-6 Al ****- carbamoyl groups, such as phenyl ECHIRUKARUBAMOIRU etc., (xxxvii) A phenylcarbamoyl machine, a phenyl (xxxviii) low-grade Al ****- carbonylamino machine (For example, phenyl C1-6 Al ****- carbonylamino machines, such as phenyl MECHIRU carbonylamino and phenyl ethyl carbonylamino) etc., (xxxix) a phenyl low-grade alkylamino machine (for example, phenyl methylamino --) Phenyl C1-6 alkylamino machines, such as phenyl ethylamino etc., (xxxx) a phenyl low-grade ARUKIRU sulfonyl group (for example, phenyl methylsulfonyl --) Phenyl C1-6 ARUKIRU sulfonyl groups, such as phenyl ethyl sulfo nil etc., (xxxxi) A phenyl sulfonyl group, a phenyl (xxxxii) low-grade ARUKIRU sulfinyl group a (phenyls [, such as phenyl MECHIRUSURUFINIRU and phenyl ethyl SURUFINIRU,] C1-6 ARUKIRU sulfinyl group [for example,]) phenyls (xxxxiii) low-grade ARUKIRU sulfonylamino machine (for example, phenyl methylsulfonylamino --) phenyl sulfonylamino machines (the above (xxv) -- or (xxxxiv) a phenyl group --), such as phenyl C1-6 ARUKIRU sulfonylamino machines (xxxxiv), such as phenyl ethyl sulfonylamino Mono-[the Naff Chill machine, a ****- phenyl low-grade alkyl group, a G phenyl low-grade alkyl group,] -**** ****- low-grade Al ****- carbonyloxy group, G phenyl low-grade Al ****- carbonyloxy group, A phenoxy group, a ****- phenyl low-grade Al ****- carbonyl group, a G phenyl low-grade Al ****- carbonyl group, A benzoyl group, a FENOKISHI carbonyl group, a phenyl low-grade Al ****- carbamoyl group, A phenylcarbamoyl machine, a phenyl low-grade Al ****- carbonylamino machine, A phenyl low-grade alkylamino machine, a phenyl low-grade ARUKIRU sulfonyl group, [a phenyl sulfonyl group, a phenyl low-grade ARUKIRU sulfinyl group, a phenyl low-grade ARUKIRU sulfonylamino machine, and a phenyl sulfonylamino machine] furthermore, a low-grade alkyl group (for example, MECHIRU, ethyl, and a pro pill --) An iso pro pill, butyl, sec-butyl, tert-butyl, Penn Chill, Lower alkoxy groups, such as C1-6 ARUKIRU, such as HEKISHIRU, (for example, [METOKISHI and]) Ethoxy ** propoxy, isopropoxy, butoxy one, iso butoxy, C1-6 alkoxy **, such as sec-butoxy and tert-butoxy, halogen atoms (for example, Krol, Blom, iodine, etc.), a hydroxy group, a benzyloxy machine, an amino group, a Monod low-grade alkylamino machine (for example) Monod C1-6 alkylamino, such as methylamino, ethylamino, and propylamino etc., A G low-grade alkylamino

machine (for example, G C1-6 alkylamino, such as dimethylamino and diethylamino etc.), you may have 1 to 4 substituents chosen from a nitro group, low-grade Al ****- carbonyl groups (for example, C1-6 Al ****- Calvo Nils, such as MECHIRUKARUBONIRU, ethyl KARUBONIRU, and butyl KARUBONIRU etc.), a benzoyl group, etc. etc. -- it is mentioned. This phenyl group may have these 1 to 4 substituents.

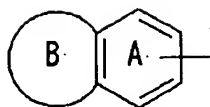
[0017] As the above-mentioned "low-grade alkyl group which may be halogenated" For example, the low-grade alkyl group which may have 1 to 3 halogen atoms (for example, Krol, Blom, iodine, etc.) for example, MECHIRU, ethyl, a pro pill, an iso pro pill, butyl, and sec-butyl - He is mentioned by C1-6 alkyl-group Hitoshi, such as tert-butyl, Penn Chill, and HEKISHIRU, etc., and as an example MECHIRU, chloromethyl, difluoromethyl, trichloromethyl, trifluoromethyl, Ethyl, 2-bromo ethyl, 2 and 2, 2-trifluoroethyl, a pro pill, 3, 3, and 3-bird fluoropropyl, an iso pro pill, butyl, 4 and 4, 4-trifluoro butyl, Iso butyl, sec-butyl, tert-butyl, Penn Chill, iso PENCHIRU, neopentyl one, 5 and 5, 5-trifluoro PENCHIRU, HEKISHIRU, 6 and 6, 6-trifluoro HEKISHIRU, etc. are mentioned. As the above-mentioned "lower alkoxy group which may be halogenated" For example, the lower alkoxy group which may have 1 to 3 halogen atoms (for example, Krol, Blom, iodine, etc.) for example, METOKISHI and ethoxy ** propoxy, isopropoxy, and butoxy one -- He is mentioned by C1-6 alkoxy-group Hitoshi, such as iso butoxy, sec-butoxy, and tert-butoxy, etc., and as an example For example, METOKISHI, difluoro METOKISHI, trifluoro METOKISHI, and ethoxy ** 2, 2, and 2-trifluoroethoxy, propoxy ones, isopropoxy, butoxy one, 4 and 4, 4-trifluoro butoxy, iso butoxy, sec-butoxy, pentyloxy one, hexyloxy one, etc. are mentioned. As the above-mentioned "low-grade ARUKIRUCHIO machine which may be halogenated" For example, the low-grade ARUKIRUCHIO machine which may have 1 to 3 halogen atoms (for example, Krol, Blom, iodine, etc.) (For example, [, and]) [MECHIRUCHIO, ECHIRUCHIO and] [pro] [iso pro] C1-6 ARUKIRUCHIO machines, such as BUCHIRUCHIO, iso BUCHIRUCHIO, sec-BUCHIRUCHIO, and tert-BUCHIRUCHIO, etc. -- etc. -- [it is mentioned and] as an example MECHIRUCHIO, difluoro MECHIRUCHIO, trifluoro MECHIRUCHIO, ECHIRUCHIO, Pro PIRUCHIO, iso pro PIRUCHIO, BUCHIRUCHIO, 4 and 4, 4-trifluoro BUCHIRUCHIO, iso BUCHIRUCHIO, sec-BUCHIRUCHIO, tert-BUCHIRUCHIO, pliers RUCHIO, HEKISHIRUCHIO, etc. are mentioned.

[0018] As a "substituent" of ", by the phenyl group which may be condensed, this phenyl group may have a substituent", preferably (i) an amino group and (ii) Monod low-grade alkylamino machine (for example, methylamino --) Monod C1-6 alkylamino machines, such as ethylamino and propylamino etc., (iii) A G low-grade alkylamino machine (for example, G C1-6 alkylamino

machines, such as dimethylamino and diethylamino etc.), (iv) For example, 5 or the 7 membered-ring-like amino group which may have 1 to 3 hetero atoms chosen from a nitrogen atom, an oxygen atom, a sulfur atom, etc. in addition to one nitrogen atom (For example, pyrrolidino, piperidino, piperazino, morpholino, thiomorpholino, etc.), (v) a low-grade Al ****-carbonylamino machine (for example, acetylamino --) Propionylamino, the C1-6 Al ****-carbonylamino machine of BUCHIRIRU amino **, etc., (vi) low-grade ARUKIRU sulfonylamino machines (for example, C1-6 ARUKIRU sulfonylamino machines, such as methylsulfonylamino, ethyl sulfonylamino, and pro pill sulfonylamino etc.) and phenyl (vii) low-grade alkylamino (for example, phenyl methylamino --) Phenyl C1-6 alkylamino, such as phenyl ethylamino etc., (viii) A phenyl low-grade ARUKIRU sulfonylamino machine (For example, phenyl C1-6 Al ****- sulfonylamino machines, such as phenyl methylsulfonylamino and phenyl ethyl sulfonylamino) etc., (ix) A phenyl sulfonylamino machine, (x) halogen atom (For example, a fluoro, Krol, etc.), and the low-grade alkyl groups by which (xi) halogenation may be carried out And (xii) the lower alkoxy group which may be halogenated (For example, MECHIRU, ethyl, an iso pro pill, tert-butyl, trifluoromethyl, etc.) for example, METOKISHI and ethoxy ** isopropoxy and tert-butoxy -- trifluoro METOKISHI etc. -- etc. -- [it is mentioned and / G low-grade alkylamino machine] especially (For example, G C1-6 alkylamino machines, such as dimethylamino and diethylamino) etc., 5 or 7 membered-ring-like amino groups (for example, pyrrolidino, piperidino, piperazino, morpholino, thiomorpholino, etc.) etc. which may have 1 to 3 hetero atoms chosen from a nitrogen atom, an oxygen atom, a sulfur atom, etc. in addition to one nitrogen atom are desirable. As an example which the "phenyl group" of this phenyl group having a substituent" condenses by the phenyl group which may be **(ed) "condensed For example, when condensing with the monocycle type heterocycle which may have (1) substituent, (2) It condenses with 2 ring type heterocycle which may have a substituent, or when condensing with two same or different monocycles (however, at least one ring is monocycle type heterocycle), the case where it condenses with 3 ring type heterocycle which may have (3) substituents etc. is mentioned.

[0019] as an example in case the phenyl group of "this phenyl group may have a substituent by the phenyl group which may be condensed" of the above (1) condenses with monocycle type heterocycle -- a formula

[Chemical formula 2]



The benzene ring to which A ring may have a substituent, and B ring show among [type the heterocycle which may have a substituent. The basis expressed with] is mentioned. As a substituent of A ring; the above-mentioned "substituent" etc. of "it is the phenyl group which may be condensed and this phenyl group may have a substituent" is mentioned, and the number of substituents is 1 to 3 pieces.

[0020] 4 to 14 member (preferably 5 or 9 members) aromatic series or non-aromatic heterocycle etc. which contains 1 to 4 hetero atoms chosen from a nitrogen atom, an oxygen atom, and a sulfur atom as "heterocycle" of "the heterocycle which may have a substituent" shown with B ring; for example is mentioned. Specifically For example, PIRIJIN, PIRAJIN, PIRIMIJIN, IMIDAZORU, A franc, CHIOFEN, dihydroPIRIJIN, diazepine, oxazepine, Pylori gin, PIPERIJIN, hexamethyleneimine, heptamethyleneimine, A tetrahydro franc, PIPERAJIN, gay PIPERAJIN, tetrahydro oxazepine, MORUHORIN, CHIOMORUHORIN, PIRORU, PIRAZORU, 1 and 2, 3-bird AZORU, OKISAZORU, oxazolidine, thia ZORU, thiazolidine, ISOOKI Southall, imidazoline, etc. are mentioned. Among these, the non-aromatic heterocycle of 5 to 9 membered-rings containing one hetero atom or two same or different hetero atoms (For example, pylori gin, PIPERIJIN, hexamethyleneimine, heptamethyleneimine, a tetrahydro franc, PIPERAJIN, gay PIPERAJIN, tetrahydro oxazepine, MORUHORIN, CHIOMORUHORIN, etc.) etc. -- it is desirable. The non-aromatic heterocycle containing one hetero atom chosen from the non-aromatic heterocycle, the (2)1 piece nitrogen atom and the nitrogen atom, oxygen atom, and sulfur atom containing one hetero atom especially chosen from (1), for example, a nitrogen atom, an oxygen atom, and a sulfur atom etc. is desirable. As a "substituent" of "the heterocycle which may have a substituent" shown with B ring For example, (i) halogen atom (for example, a fluoro, Krol, Blom, iodine, etc.), (ii) A nitro group, a cyano group (iii), (iv) OKISO machine, the (v) hydroxy group, (vi) a low-grade alkyl group (for example, MECHIRU, ethyl, a pro pill, and an iso pro pill --) Lower alkoxy groups, such as C1-6 alkyl groups (vii), such as butyl, iso butyl, tert-butyl, and sec-butyl, for example, METOKISHI and ethoxy, propyloxy and isopropyloxy -- Low-grade (viii) ARUKIRUCHIO machines, such as C1-6 alkoxy groups, such as butyloxy, (For example, C1-6 ARUKIRUCHIO machines, such as MECHIRUCHIO, ECHIRUCHIO, and pro PIRUCHIO) etc., (ix) an amino group and (x) Monod low-grade alkylamino machine (for example, methylamino --) In addition to (xi) G low-grade alkylamino machines (for example, G C1-6 alkylamino machines, such as dimethylamino and diethylamino etc.), for example, (xii), a carbon atom, such as Monod C1-6 alkylamino

machines, such as ethylamino and propylamino, and one nitrogen atom, a nitrogen atom, 5 or the 7 membered-ring-like amino group which may have 1 to 3 hetero atoms chosen from an oxygen atom, a sulfur atom, etc. (For example, pyrrolidino, piperidino, piperazino, morpholino, thiomorpholino, etc.), (xiii) a low-grade AI ****- carbonylamino machine (for example, acetylamino --) Propionylamino, the C1-6 AI ****- carbonylamino machine of BUCHIRIRU amino **, etc., (xiv) a low-grade ARUKIRU sulfonylamino machine (for example, methylsulfonylamino --) C1-6 AI ****- carbonylamino machines, such as ethyl sulfonylamino etc., (xv) Low-grade alkoxy carbonyl group (for example, [METOKISHIKARUBONIRU and]) C1-6 alkoxy carbonyl groups, such as ethoxycarbonyl and propoxy KARUBONIRU etc., (xvi) A KARUBOKISHI machine, a low-grade (xvii) ARUKIRU carbonyl group (For example, C1-6 AI ****- carbonyl groups, such as MECHIRUKARUBONIRU, ethyl KARUBONIRU, and propylcarbonyl) etc., (xviii) A carbamoyl group, Monod (xix) low-grade ARUKIRU carbamoyl groups (for example, Monod C1-6 AI ****- carbamoyl groups, such as methylcarbamoyl and ethyl KARUBAMOIRU etc.), (xx) G low-grade ARUKIRU carbamoyl group (for example) G C1-6 AI ****- carbamoyl groups, such as JIMECHIRUKARUBAMOIRU and diethylcarbamoyl etc., (xxi) 1 to 5 pieces chosen from low-grade ARUKIRU sulfonyl groups (for example, C1-6 ARUKIRU sulfonyl groups, such as methylsulfonyl, ethyl sulfo nil, and pro pill sulfo nil etc.) etc. are used. An OKISO machine, low-grade alkyl groups (for example, C1-6 alkyl groups, such as MECHIRU, ethyl, a pro pill, an iso pro pill, butyl, iso butyl, tert-butyl, and sec-butyl etc.), etc. are desirable especially. Especially an OKISO machine etc. is desirable.

[0021] B ring when B ring has a nitrogen atom in a ring is a formula in a ring. R1 shows the heterocyclic machine which may have the hydrocarbon group, acyl group, or substituent which may have a hydrogen atom and a substituent among a >N-R1[type. You may have the basis expressed with]. Furthermore, B ring does not have the above-mentioned substituent (i) or (xxi) 1, and you may have it three pieces. [the "hydrocarbon group" of "the hydrocarbon group which may have a substituent" shown by R1] The basis excluding one hydrogen atom from the hydrocarbon compound is shown, and the following alkyl groups, an alkenyl group, an alkynyl group, a cycloalkyl machine, an aryl group, an ARARUKIRU machine, the basis of such combination, etc. are mentioned as the example, for example. Among these, C1 -16 hydrocarbon group etc. is desirable. (1) an alkyl group (for example, MECHIRU, ethyl, a pro pill, and an iso pro pill --) Butyl, iso butyl, tert-butyl, sec-butyl, Penn Chill, C, such as HEKISHIRU, 1-6 alkyl-group (2) alkenyl groups for example, vinyl, ARIRU, isopropenyl, butenyl, and iso butenyl -- C, such as sec-butenyl, 2-6 alkenyl-group (3) alkynyl groups (4) cycloalkyl machine (For example, C2-6 alkynyl groups, such as propargyl, ECHINIRU, butynyl, and 1-hexynil etc.) (Five) bridge ring type low-grade saturated hydrocarbon machine (For

example, C3-6 cycloalkyl machines, such as a cyclo pro pill, cyclo butyl, cyclopentyl, and cyclohexyl etc.) (For example, bicyclo [3.2.1] oct 2-IRU, bicyclo [3.3.1] ****- 2 - [IRU and]) Bridge ring type [, such as *****- 1-IRU,] C8-14 saturated-hydrocarbon machine (6) aryl groups for example, a phenyl, 1-Naff Chill, 2-Naff Chill, BIFENIRU, and 2-indenyl -- C6-14 aryl groups, such as 2-anthryl, etc. -- desirable -- (7) ARARUKIRU machines (for example, Ben-Jill, phenylethyl, phenylpropyl, phenyl butyl, and Feni Le Pen Chill --), such as a phenyl group phenyl C1-10 ARUKIRU;, such as phenyl HEKISHIRU, -- Naff ****- C1-6 ARUKIRU;, such as alpha-NAFUCHIRUMECHIRU, -- [and] [diphenyl] (8) ****- roux alkenyl groups (for example, styryl --), such as C7-16 ARARUKIRU machines, such as diphenyl C1-3 ARUKIRU, such as diphenylethyl (9) Ali Lou C2-12 alkynyl groups, such as C6-14 Ali Lou C2-12 alkenyl groups, such as phenyl C2-12 ARUKENIRU, such as SHINNAMIRU, 4-phenyl 2-butenyl, and 4-phenyl 3-butenyl, (For example, C6-14 Ali Lou C2-12 alkynyl groups, such as phenyl C2 -12 alkynyl, such as phenyl ECHINIRU, 3-phenyl 2-propynyl, and 3-phenyl 1-propynyl, etc.) (10) cycloalkyl alkyl group (for example) Cyclopropyl methyl, cyclo butyl MECHIRU, cyclopentyl MECHIRU, cyclohexyl MECHIRU, cycloheptyl MECHIRU, cyclo propylethyl, cyclo butyl ethyl, cyclopentyl ethyl, cyclohexyl ethyl, cycloheptyl ethyl, cyclo PUROPIRU PUROPIRU, A cyclo butyl pro pill, a cyclopentyl pro pill, a cyclohexyl pro pill, a cycloheptyl pro pill; cyclo pro pill butyl, cyclo butyl butyl, cyclopentyl butyl, cyclohexyl butyl, cycloheptyl butyl, cyclo pro pill PENCHIRU, C3-7 : cycloalkyl C1-6 alkyl groups, such as cyclo butyl PENCHIRU, cyclopentyl PENCHIRU, cyclohexyl PENCHIRU, cycloheptyl PENCHIRU, cyclo pro pill HEKISHIRU, cyclo butyl HEKISHIRU, cyclopentyl HEKISHIRU, and cyclohexyl HEKISHIRU etc. (11) Ali Lou Ali Lou C1-10 alkyl groups (for example, BIFENIRUMECHIRU, BIFE nil ethyl, etc.)

[0022] As a desirable thing of the "hydrocarbon group" of "the hydrocarbon group which may have a substituent" shown by R1, they are C1-6 alkyl group, a C3-6 cycloalkyl machine, a C7-16 ARARUKIRU machine, etc., for example. Furthermore, they are C7-10 ARARUKIRU machines etc. preferably (for example, phenyl C1-4 ARUKIRU, such as Ben Jill, phenylethyl, and phenylpropyl etc.). As a "substituent" of "the hydrocarbon group which may have a substituent" shown by R1 for example, (i) halogen atom (for example, a fluoro, Krol, and Blom -) The (ii) nitro group and cyano groups (iii), such as iodine, (iv) OKISO machine, (v) A hydroxy group, the low-grade alkyl group by which (vi) halogenation may be carried out, (vii) The lower alkoxy group which may be halogenated, the low-grade ARUKIRUCHIO machine which may be halogenated (viii), (ix) an amino group and (x) Monod low-grade alkylamino machine (for example, methylamino --) Monod C1-6 alkylamino machines, such as ethylamino and propylamino etc., (xi) A G low-grade alkylamino machine (for example, G C1-6 alkylamino machines, such as dimethylamino and diethylamino etc.), (xii) For example, 5 or the 7

membered-ring-like amino group which may have 1 to 3 hetero atoms chosen from a nitrogen atom, an oxygen atom, a sulfur atom, etc. in addition to a carbon atom and one nitrogen atom a (pyrrolidino, piperidino, piperazino, morpholino, thiomorpholino, etc.) low-grade (xiii) Al ****- carbonylamino machine (for example, acetylamino and propionylamino --) [for example,] Low-grade (xiv) ARUKIRU sulfonylamino machines, such as a C1-6 Al ****- carbonylamino machine of BUCHIRIRU amino ** (For example, C1-6 Al ****- sulfonylamino machines, such as methylsulfonylamino and ethyl sulfonylamino) etc., (xv) Low-grade alkoxy carbonyl group (for example, [METOKISHIKARUBONIRU and]) C1-6 alkoxy carbonyl groups, such as ethoxycarbonyl and propoxy KARUBONIRU etc., (xvi) A KARUBOKISHI machine, a low-grade (xvii) Al ****- carbonyl group (For example, C1-6 Al ****- carbonyl groups, such as MECHIRUKARUBONIRU, ethyl KARUBONIRU, and propylcarbonyl) etc., (xviii) A carbamoyl group, a CHIOKARUBAMOIRU machine, a Monod (xix) low-grade Al ****- carbamoyl group (For example, Monod C1-6 Al ****- carbamoyl groups, such as methylcarbamoyl and ethyl KARUBAMOIRU) etc., (xx) G low-grade Al ****- carbamoyl group (for example, [JIMECHIRUKARUBAMOIRU and]) Low-grade (xxi) ARUKIRU sulfonyl groups, such as G C1-6 Al ****- carbamoyl groups, such as diethylcarbamoyl, (for example, C1-6 ARUKIRU sulfonyl groups, such as methylsulfonyl, ethyl sulfo nil, and pro pill sulfo nil etc.), (xxii) A low-grade alkoxy *****- low-grade alkyl group for example, METOKISHI carbonylmethyl and ethoxy carbonylmethyl -- tert-butoxy carbonylmethyl, METOKISHI carbonylethyl, METOKISHI carbonylmethyl, METOKISHIKARUBONIRU (JIMECHIRU) MECHIRU, C1-6 Al KIRU**KARUBONIRU** C1-6 alkyl groups, such as ethoxycarbonyl (JIMECHIRU) MECHIRU and tert-butoxycarbonyl (JIMECHIRU) MECHIRU etc., (xxiii) Calvo ****- low-grade alkyl group (for example, [KARUBOKISHIRUMECHIRU and]) Calvo ****- C1-6 alkyl groups, such as KARUBOKISHIRU ethyl and KARUBOKISHIRU (JIMECHIRU) MECHIRU etc., (xxiv) The heterocyclic machine, C(xxv)6-14 aryl group which may have a substituent A (phenyl, Naff Chill, etc.) C(xxvi)7-16 ARARUKIRU machine [for example,] (For example, Ben Jill) etc. and the UREIDO machines which may have a substituent (xxvii) (For example, UREIDO, 3-MECHIRUU RAID, 3-ECHIRUU RAID, 3-phenyl RAID, 3-(4-fluoro phenyl) UREIDO, 3-(2-methylphenyl) UREIDO, 3-(4-methoxyphenyl) UREIDO, 3 - (2, 4-difluoro phenyl) [UREIDO and]) 3-[3 and 5-bis(trifluoromethyl) phenyl] UREIDO, 3-benzoRUUREIDO, 3-(1-Naff Chill) UREIDO, 3-(2-biphenyl) UREIDO, etc., (xxviii) The CHIOU RAID machine which may have a substituent for example, CHIOU RAID, 3-MECHIRUCHIOU RAID, and 3-ethyl CHIOU RAID -- 3-phenylthio RAID, 3-(4-fluoro phenyl) CHIOU RAID, 3-(4-methylphenyl) CHIOU RAID, 3-(4-methoxyphenyl) CHIOU RAID, 3-(2, 4-dichlorophenyl) CHIOU RAID, 3-benzoRUCHIOU RAID, The AMIJINO machine which may have substituents (xxix), such as 3-(1-Naff Chill) CHIOU RAID, (For example, AMIJINO, N1 - [and]) [MECHIRUAMIJINO and] [N1-ethyl] N1-phenyl AMIJINO, N1, N1-JIMECHIRUAMIJINO, N1, N2-JIMECHIRUAMIJINO, the guanidino machine

(for example, guanidino and 3-MECHIRU guanidino --) which may have substituents (xxx), such as N1-*****- N1-ethyl AMIJINO, N1, N1-JIECHIRUAMIJINO, N1-*****- N1-phenyl AMIJINO, N1, and N1-JI (4-nitrophenyl) AMIJINO The annular aminocarbonyl machine which may have substituents (xxxi), such as 3 and 3-JIMECHIRU guanidino, 3, and 3-JIECHIRU guanidino, for example, pyrrolidino KARUBONIRU, piperidino KARUBONIRU, and Calvo (4-MECHIRU piperidino) Nils -- Calvo Nils, Calvo (4-BENJIRU piperidino) Nils, (4-phenyl piperidino) Calvo Nils, [4-(4-fluoro BENZOIRU) piperidino] Calvo Nils, (4-BENZOIRU piperidino) Calvo Nils, Calvo (4-phenyl piperazino) Nils, (4-MECHIRU piperazino) [4-(4-nitrophenyl) piperazino] Calvo Nils, Calvo (4-BENJIRU piperazino) Nils, The amino thiocarbonyl group which may have substituents (xxxii), such as morpholino carbonyl and thiomorpholino carbonyl, (For example, amino CHIOKARUBONIRU, methylamino CHIOKARUBONIRU, dimethylamino CHIOKARUBONIRU, etc.), and the amino sulfonyl groups which may have a substituent (xxxiii) (for example, amino sulfo nil, methylamino sulfo nil, JIMECHIRU) Phenyls sulfonylamino which may have a substituent (xxxiv), such as amino sulfo nil for example, phenyl sulfonylamino and sulfonylamino (4-methylphenyl) -- Sulfonylamino, sulfonylamino (2, 5-dichlorophenyl), (4-chlorophenyl) Sulfonylamino, sulfonylamino (4-acetylamino phenyl), (4-methoxyphenyl) Sulfonic groups (xxxv), such as phenyl sulfonylamino, (4-nitrophenyl) (xxxvi) The Sour Finot machine, a SURUFENO (xxxvii) machine, a C(xxxviii)1-6 ARUKIRU sulfonic group A (MECHIRU sulfo, ethyl sulfo, pro pill sulfo, etc.) C(xxxix)1-6 ARUKIRUSU Rufino machine [for example,] (For example, MECHIRUSU Rufino, ECHIRUSU Rufino, pro PIRUSU Rufino, etc.), (xxxx) C1-6 ARUKIRUSURUFENO machines (for example, MECHIRUSURUFENO, ethyl SURUFENO, pro Pirus RUFENO, etc.), a phosphono (xxxxi) machine, a G (xxxxii) C1-6 alkoxy phosphoryl group (for example, [and]) [dimethoxy] [diethoxy] dipropoxy HOSUHORIRU etc. -- etc. -- from -- 1 to 5 selected pieces (preferably 1 to 3 pieces) are mentioned. Preferably Among these, a halogen atom, the alkyl group which may be halogenated, The alkoxy group, hydroxy group, nitro group which may be halogenated, A cyano group, a KARUBOKISHI machine, a C1-6 alkoxy carbonyl group, a carbamoyl group, An amino thiocarbonyl group, a Monod C1-6 Al ****- carbamoyl group, A G C1-6 Al ****- carbamoyl group, an amino group, a Monod C1-6 alkylamino machine, A G C1-6 alkylamino machine, 5 or a 7 membered-ring-like amino group, a C1-6 Al ****- carbonylamino machine, a phenyl sulfonylamino machine, a C1-6 ARUKIRU sulfonylamino machine, etc. are mentioned.

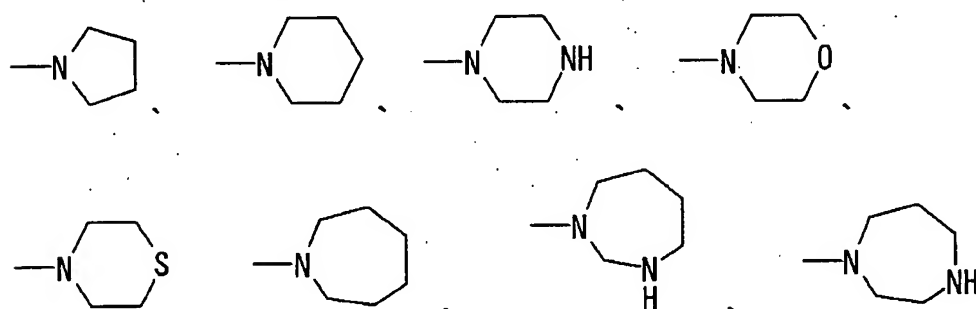
[0023] As a "heterocyclic machine" of the above "heterocyclic machine which may have a substituent" For example, the basis which removes one hydrogen atom and is made from 5 containing 1 to 6 hetero atoms (preferably 1 to 4 pieces) chosen from a nitrogen atom, an

oxygen atom, and a sulfur atom or 14 member (monocycle type, 2, or 4 ring type) heterocycle is used. As a monocycle type heterocyclic machine, PIRIJIN, PIRAJIN, PIRIMIJJIN, IMIDAZORU, A franc, CHIOFEN, dihydroPIRIJIN, diazepine, oxazepine, Pylori gin, PIPERIJIN, hexamethyleneimine, heptamethyleneimine, A tetrahydro franc, PIPERAJJIN, gay PIPERAJJIN, tetrahydro oxazepine, MORUHORIN, CHIOMORUHORIN, PIRORU, PIRAZORU, 1 and 2, 3-bird AZORU, The basis which removes one hydrogen atom and is made from monocycle type heterocycles, such as OKISAZORU, oxazolidine, thia ZORU, thiazolidine, ISOOKI Southall, imidazoline, bird AZORU, thiadiazole, oxadiazole, OKISA thiadiazole, triazine, and tetra-ZORU, is mentioned. As 2 ring type heterocycle, for example Indore, dihydroindol, Isoindole, dihydroisoindole, a benzofranc, a dihydrobenzofranc, Benzimidazole benzoxazole, benzisoxazole, Benzothia ZORU, indazole, Kino Lynne, tetrahydroquinoline, Iso KINORIN, tetrahydroisoquinoline, tetrahydro 1H-1-BENZU azepine, Tetrahydro 1H-2-BENZU azepine, tetrahydro 1H-3-BENZU azepine, The basis which removes one hydrogen atom and is made from 2 ring type heterocycles, such as tetrahydro BENZU oxazepine, quinazoline, tetrahydro quinazoline, KINOKI Sarin, tetrahydro KINOKI Sarin, BENZOJI oxane, a benzoJIOKI sole, benzothia gin, and imidazopyridine, is used. The basis which removes one hydrogen atom and is made as 3 or a 4 ring type heterocyclic machine from 3 or 4 ring type heterocycles, such as AKURIJJIN, tetrahydro AKURIJJIN, pyrrolo KINORIN, pyrrolo in DORU, cyclopent Indore, and iso indolo BENZU azepine, is mentioned.

[0024] The basis which removes one hydrogen atom and is made from monocycle or 2 ring type heterocycle as ** "heterocyclic machine" is desirable. The "substituent" of "the heterocycle which may have a substituent" shown with the above-mentioned B ring as a "substituent" of ** "heterocyclic machine which may have a substituent" is mentioned, and the number of substituents is 1 to 5 pieces. As "a hydrocarbon group which may have a substituent" shown by R1, preferably The C7-16 ARARUKIRU machines (preferably Ben Jill etc.) which may have 1 to 5 substituents chosen from a halogen atom, C1-6 ARUKIRU, C1-6 alkoxy ** nitroglycerine, cyano, and HIDOROKISHI are mentioned. as the "acyl group" shown by the above R1 -- for example -- formula: $-(C=O)-R_2$, $-(C=O)-OR_2$, and $-(C=O)-NR_2R_3$, $-SO_2-R_2$, $-SO-R_2$, and $-(C=S)-OR_2$ or -- among a $-(C=S)NR_2R_3$ [type R2 and R3 may form the nitrogen ring machine which may have a substituent with the nitrogen atom which shows the heterocyclic machine which may have the hydrocarbon group or (iii) substituent which may have the (i) hydrogen atom and the (ii) substituent, or combines R2 and R3 mutually and adjoins, respectively. The acyl group expressed with] is mentioned. among these -- desirable -- formula: $-(C=O)-R_2$ -- or $-(C=O)-$ each sign shows the above and this meaning among a NR_2R_3 [type. It is the acyl group expressed with].

[0025] What has "the hydrocarbon group which may have a substituent" shown by R2 or R3 and "the heterocyclic machine which may have a substituent" be [the same as that of "the hydrocarbon group which may have a substituent" and "the heterocyclic machine which may have a substituent" shown by the above R1] it is mentioned, respectively. As "a nitrogen ring machine which may have a substituent" formed by R2 and R3 The nitrogen-containing saturation heterocyclic machine of 5 or 9 members (preferably 5 or 7 members) which may contain 1 to 3 hetero atoms chosen, for example from a nitrogen atom, an oxygen atom, and a sulfur atom in addition to a carbon atom and one nitrogen atom is mentioned. More specifically, it is a formula, for example.

[Chemical formula 3]



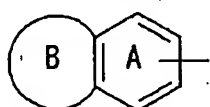
It comes out and the basis expressed is mentioned.

[0026] The thing same as a "substituent" of ** "nitrogen ring machine which may have a substituent" as the "substituent" of "the heterocycle which may have a substituent" shown with the above-mentioned B ring is mentioned, and the number of substituents is 1 to 5 pieces. C1-6 ARUKIRU by which the (i) hydrogen atom and (ii) halogenation may be preferably carried out as R2 and R3, (iii) C -- one - six -- ARUKIRU -- and -- C -- one - six -- ARUKOKISHI -- from -- choosing -- having -- a substituent -- one -- or -- three -- a piece -- having -- **** -- C -- six - ten -- ARIRU -- C (iii) -- seven - 16 -- ARARUKIRU (an example, Ben Jill, etc.) -- (-- iv --) -- five -- or -- six -- a member -- heterocycle -- machines (an example, pyridyl, CHIENIRU, a frill, etc.) -- etc. -- mentioning -- having . As an "acyl group" shown by the above R1, preferably HORUMIRU and C1-6 Al ****- Calvo Nils (an example --) who may be halogenated 5 or 6 member heterocyclic Calvo Nils (an example --), such as ASECHIRU, trifluoroacetyl, and pro PIONIRU Pyridyl KARUBONIRU, CHIENIRUKARUBONIRU, frill KARUBONIRU, etc., C6-14 Ali Lou Calvo Nils (an example, BENZOIRU, and 1-naphthoyl --) C7-16 *****- Calvo Nils

(an example, phenylacetyl, 3-phenyl pro PIONIRU, etc.), such as 2-naphthoyl, C6-10 ARIRU sulfo nil (an example, benzenesulphonyl, NAFUCHIRU sulfo nil, etc.), etc. are mentioned. R1 is a hydrogen atom, C1-6 ARUKIRU, C1-6 Al ****- Calvo Nils, C6-14 Ali Lou Calvo Nils, etc. preferably.

[0027] The above-mentioned formula

[Chemical formula 4]



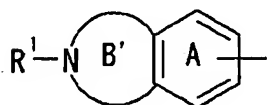
[come out and] as an example of a basis expressed 2 and 3-dihydrobenzofranc; 3 and 4-dihydro2H-1-benzothiopyran; 2, 3-dihydro1H-Indore;1, 2 and 3, 4-tetrahydroquinoline;2, 3-dihydro1H-isoindeole;1, 2 and 3, 4-tetrahydroisoquinoline;2, 3 and 4, 5-tetrahydro 1H-1-BENZU azepine, BENZU azepine;1, such as 2, 3, 4, 5-tetrahydro 1H-2-BENZU azepine, 2, 3 and 4, and 5-tetrahydro 1H-3-BENZU azepine, 2, 3, 4 and 5, 6-hexahydro 1-BENZU azocine, BENZU azocine;2, such as 1, 2, 3, 4, 5, 6-hexahydro 2-BENZU azocine, 1, 2, 3, 4 and 5, and 6-hexahydro 3-BENZU azocine, 3, 4, 5 and 6, 7-hexahydro 1H-1-BENZUAZONIN, 2, 3, 4, 5, 6, 7-hexahydro 1H-2-BENZUAZONIN, 2, 3, 4, 5 and 6, 7-hexahydro 1H-3-BENZUAZONIN, 2, 3, 4, 5, 6, Benzimidazoles [, such as a benzothia ZORU;2, such as benzoxazole;2, such as BENZUAZONIN;2, such as 7-hexahydro 1H-4-BENZUAZONIN, and 3-dihydrobenzoxazole, and 3-dihydrobenzothia ZORU, and 3-dihydro1H-benzimidazole,]; 3, 4-dihydro1H-2, 1-benzoxadine, 3, 4-dihydro1H-2, 3-benzoxadine, 3, 4-dihydro2H-1, 2-benzoxadine, 3, 4-dihydro2H-1, 4-benzoxadine, Benzoxadine;3, such as 3, 4-dihydro2H-1, 3-benzoxadine, 3, 4-dihydro2H-3, and 1-benzoxadine, 4-dihydro1H-2, 1-benzothia gin, 3, 4-dihydro1H-2, 3-benzothia gin, 3, 4-dihydro2H-1, 2-benzothia gin, Benzothia gin;1, such as 3, 4-dihydro2H-1, 4-benzothia gin, 3, 4-dihydro2H-1, 3-benzothia gin, 3, 4-dihydro2H-3, and 1-benzothia gin, 2 and 3, 4-tetrahydro cinnoline, 1, 2 and 3, 4-tetrahydro lid RAJIN, BenzoJIAJIN;3, such as 1, 2, 3, 4-tetrahydro quinazoline, 1, 2 and 3, and 4-tetrahydro KINOKI Sarin, 4-dihydro1, 2-BENZUOKISACHIIN, 3, 4-dihydro2, 1-BENZUOKISACHIIN, 2, 3-dihydro1, 4-BENZUOKISACHIIN, 1, 4-dihydro2, 3-BENZUOKISACHIIN, 4H-1, 3-BENZUOKISACHIIN, BENZUOKISACHIIN;3, such as 4H-3 and 1-BENZUOKISACHIIN, 4-dihydro1, 2-benzodioxine, 2, 3-dihydro1, 4-benzodioxine, 1, 4-dihydro2, 3-benzodioxine, Benzodioxine;3, such as 4H-1 and 3-benzodioxine, 4-dihydro1, 2-BENZUJICHIIN, 2, 3-dihydro1, 4-BENZUJICHIIN, 1, 4-dihydro2, 3-BENZUJICHIIN, BENZUJICHIIN;2, such as 4H-1 and 3-BENZUJICHIIN, 3 and 4,

5-tetrahydro 1, 2-BENZU oxazepine, 2, 3, 4, 5-tetrahydro 1, 3-BENZU oxazepine, 2, 3 and 4, 5-tetrahydro 1, 4-BENZU oxazepine, 2, 3 and 4, 5-tetrahydro 1, 5-BENZU oxazepine, 1, 3, 4, 5-tetrahydro 2, 1-BENZU oxazepine, 1, 3 and 4, 5-tetrahydro 2, 3-BENZU oxazepine, 1, 3, 4, 5-tetrahydro 2, 4-BENZU oxazepine, 1, 2 and 4, 5-tetrahydro 3, 1-BENZU oxazepine, BENZU oxazepine;2, such as 1, 2, 4, 5-tetrahydro 3, 2-BENZU oxazepine, 1, 2 and 3, 5-tetrahydro 4, and 1-BENZU oxazepine, 3 and 4, 5-tetrahydro 1, 2-benzothiazepine, 2, 3, 4, 5-tetrahydro 1, 4-benzothiazepine, 2, 3 and 4, 5-tetrahydro 1, 5-benzothiazepine, 1, 3, 4, 5-tetrahydro 2, 1-benzothiazepine, 1, 3 and 4, 5-tetrahydro 2, 4-benzothiazepine, 1, 2, 4, 5-tetrahydro 3, 1-benzothiazepine, 1, 2 and 4, 5-tetrahydro 3, 2-benzothiazepine, Benzothiazepine;2, such as 1, 2, 3, 5-tetrahydro 4, and 1-benzothiazepine, 3 and 4, 5-tetrahydro 1H-1, 2-benzothiazepine, 2, 3 and 4, 5-tetrahydro 1H-1, 3-benzodiazepine, 2, 3, 4, 5-tetrahydro 1H-1, 4-benzodiazepine, 2, 3, 4, 5-tetrahydro 1H-1, 5-benzodiazepine, 2, 3, 4, 5-tetrahydro 1H-2, 3-benzodiazepine, Benzodiazepine;4, such as 2, 3, 4, 5-tetrahydro 1H-2, and 4-benzodiazepine, 5-dihydro1, 3-BENZOJI oxepin, 4, 5-dihydro3H-1, 2-BENZOJI oxepin, 2, 3-dihydro5H-1, 4-BENZOJI oxepin, 3, 4-dihydro2H-1, 5-BENZOJI oxepin, 4, 5-dihydro1H-2, 3-BENZOJI oxepin, BENZOJI oxepin;4, such as 1, 5-dihydro2, and 4-BENZOJI oxepin, 5-dihydro1H-2, 3-benzothiepine, BENZOJI thiepine, such as 1, 5-dihydro2, 4-BENZOJI thiepine, 3, 4-dihydro2H-1, 5-BENZOJI thiepine, 2, 3-dihydro5H-1, and 4-BENZOJI thiepine, 3, 4 and 5, 6-tetrahydro 2H-1, 5-BENZUOKISAZOSHIN, BENZUOKISAZOSHIN;3, such as 3, 4, 5, 6-tetrahydro 2H-1, and 6-BENZUOKISAZOSHIN, 4 and 5, 6-tetrahydro 2H-1, 5-benzothia ZOSHIN, 3, 4, 5, 6-tetrahydro 2H-1, Benzothia ZOSHIN;, such as 6-benzothia ZOSHIN 1, 2, 3, 4, 5, 6-hexahydro 1, BenzoJIOKISOSHIN;1, such as BENZUOKISA thiosin;2, such as BENZOJI azocine;2, such as 6-BENZOJI azocine, 3 and 4, 5-tetrahydro 1, and 6-BENZUOKISA thiosin, 3 and 4, 5-tetrahydro 1, and 6-benzoJIOKISOSHIN, 3, 5-Ben Benzobird oxepin;3, such as ZOTORI oxepin, 5H-1, 3, and 4-benzobird oxepin, 4-dihydro1H-5, 2, 1-BENZUOKISA thiazepine, 3, 4-dihydro2H-5, 1, 2-BENZUOKISA thiazepine, 4, and 5-dihydro -- 3, 1, and 4-BENZUOKISA thiazepine -- BENZUOKISA thiazepine;2, such as 4, 5-dihydro3H-1, 2, and 5-BENZUOKISA thiazepine, 3 and 4, and 5-tetrahydro -- BENZUOKISA diazepine;2, such as 1, 3, and 4-BENZUOKISA diazepine, 3 and 4, and 5-tetrahydro -- 1 and 3 -- benzobird azepine;4, such as BENZU thia diazepine;2, such as 5-BENZU thia diazepine, 3 and 4, 5-tetrahydro 1H-1, 2, and 5-benzobird azepine, and 5-dihydro -- 1, 3, and 2-benzoOKISA thiepine -- 4, 5-dihydro1H-2, 3-BENZUOKISA thiepine, 3, 4-dihydro2H-1, 5-BENZUOKISA thiepine, 4, 5-dihydro3H-1, 2-BENZUOKISA thiepine, 4, 5-dihydro3H-2, 1-BENZUOKISA thiepine, 2, 3-dihydro5H-1, 4-BENZUOKISA thiepine, 2, 3-dihydro5H-4, 1-BENZUOKISA thiepine, etc., Especially 2, 3, 4, 5-tetrahydro 1H-3-BENZU azepine, The basis which removes one hydrogen atom and is made from 2 ring type condensation benzene rings, such as 2, 3, 4, 5-tetrahydro 1H-2-BENZU azepine, 2, 3-dihydro1H-Indore, 2, 3 and 4, 5-tetrahydro 1, and 4-BENZU oxazepine, is

mentioned.

[0028] Among these, as a desirable example, it is a formula.

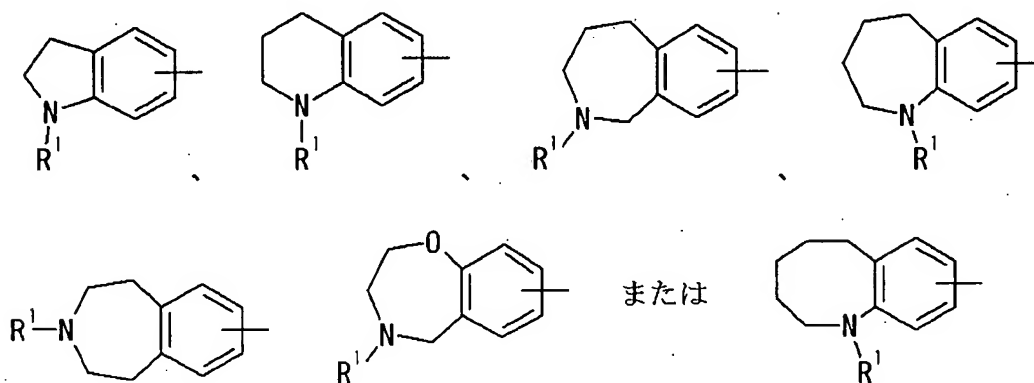
[Chemical formula 5]



Each sign of 5 or the nitrogen-containing heterocycle of 9 members, and others by which B' ring may be further replaced with the OKISO machine shows the above and this meaning among [type. The basis expressed with] is mentioned.

[0029] As "nitrogen-containing heterocycle of 5 or 9 members" of ** "nitrogen-containing heterocycle of 5 which may be further replaced with the OKISO machine, or 9 members" The nitrogen-containing heterocycle of 5 or 9 members which may contain 1 to 3 hetero atoms chosen, for example from a nitrogen atom, an oxygen atom, and a sulfur atom in addition to a carbon atom and one nitrogen atom is mentioned. The non-aromatic nitrogen-containing heterocycles (for example, pylori gin, PIPERIJIN, hexamethyleneimine, heptamethyleneimine, PIPERAJIN, gay PIPERAJIN, tetrahydro oxazepine, MORUHORIN, CHIOMORUHORIN, etc.) of 5 or 9 members etc. are used preferably. Among these, as a more desirable example, it is a formula.

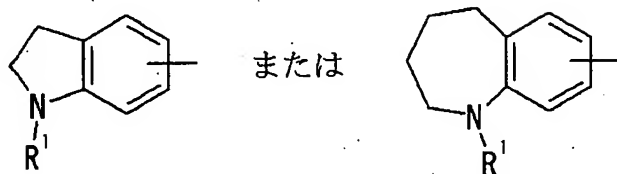
[Chemical formula 6]



R1 shows the above and this meaning among [type. The basis expressed with] is mentioned.

It is a formula especially preferably.

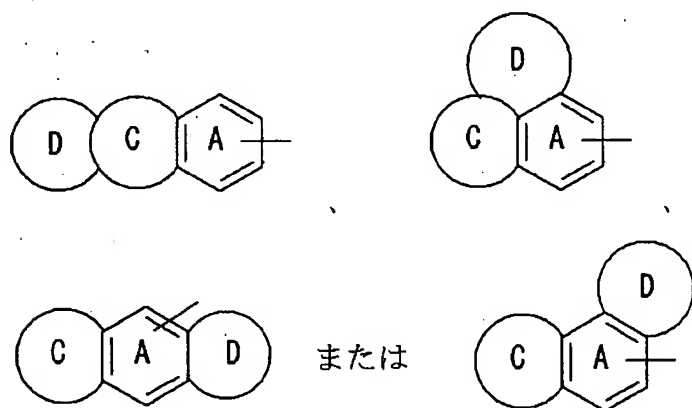
[Chemical formula 7]



R1 shows the above and this meaning among [type. The basis expressed with] is mentioned.

[0030] The phenyl group of ", by the phenyl group which may be condensed, this phenyl group may have a substituent" of the above (2) condenses with 2 ring type heterocycle which may have a substituent. Or as an example in the case of condensing with two same or different monocycles (however, at least one ring being monocycle type heterocycle), it is a formula, for example.

[Chemical formula 8]



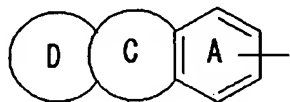
The heterocycle in which, as for A ring, either the above, this meaning, C ring or D ring may have a substituent, and another side show among [type 5 to 9 membered-rings which may have a substituent. The basis expressed with] is mentioned.

[0031] As "heterocycle" of "the heterocycle which may have a substituent" shown with C ring or

D ring, "the heterocycle which may have a substituent" shown with B ring is mentioned. ["5 to 9 membered-rings" of the "5 to 9 which may have a substituent membered-rings" shown with C ring or D ring] You may contain 1 to 3 hetero atoms chosen from a nitrogen atom, an oxygen atom, and a sulfur atom. For example, 5 or 9 member heterocycle (for example, [PIRIJIN, PIRAJIN, PIRIMIJIN and] IMIDAZORU, Fran, CHIOFEN, dihydroPIRIJIN, diazepine, Oxazepine, pylori gin, PIPERIJIN, hexamethyleneimine, heptamethyleneimine, A tetrahydro franc, PIPERAJIN, gay PIPERAJIN, tetrahydro oxazepine, 5 to 9 member carbon rings (for example, benzene, a cyclo pen tongue, a cyclo pen ten, cyclo HEKISAN, cyclo HEKISEN, cyclohexa JIEN, cycloheptane, cyclo HEPUTEN, cycloheptadiene, etc.), such as MORUHORIN and CHIOMORUHORIN, etc. are mentioned. Among these, 5 to 7 membered-rings are desirable. Benzene, cyclo HEKISAN, etc. are desirable especially. The thing same as a "substituent" of "5 to 9 membered-rings which may have a substituent" as the "substituent" of "the heterocycle which may have a substituent" shown with the above-mentioned B ring is mentioned.

[0032] The above-mentioned formula

[Chemical formula 9]

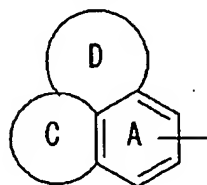


Each sign shows the above and this meaning among [type. As an example of a basis expressed with], KARUBAZORU, 1, 2, 3, 4 and 4a, 9a-hexahydro KARUBAZORU, 9, 10-dihydroAKURIJIN, 1, 2 and 3, 4-tetrahydro AKURIJIN, 10 and 11-dihydro5H-JIBENZU [b, f] azepine, 5, 6 and 7, 12-tetrahydro JIBENZU [b, g] azocine, 6 and 11-dihydro5H-JIBENZU [b, e] azepine, 6, 7-dihydro5H-JIBENZU [c, e] azepine, 5, 6, 11, and 12-tetrahydro JIBENZU [b, f] azocine, a dibenzo franc, 9H-KISANTEN, 10, 11-dihydroJIBENZU [b, f] oxepin, 6 and 11-dihydroJIBENZU [b, e] oxepin, 6, 7-dihydro5H-JIBENZU [b, g] OKISOSHIN, Dibenzo CHIOFEN, a 9H-thioxan ten, 10, 11-hydrodibenzo [b, f] thiepine, 6 and 11-hydrodibenzo [b, e] thiepine, 6, and 7-dihydro5H-[b and dibenzo g] thiosin, 10H-FENO thia gin, 10H-phenoxazine, 5, 10-dihydroFENAJIN, 10, [b, f], and 11-dibenzo [1, 4] thiazepine, 10, 11-dihydroJIBENZU [b, f], and [1, 4] oxazepine, 2, 3, 5, 6, 11, and 11a-hexahydro 1H-[2 and 1-pyrrolo b] [3] BENZU azepine, 10, [b, e], and 11-dihydro5H-dibenzo [1, 4] diazepine, 5, 11-dihydroJIBENZU [b, e], and [1, 4] oxazepine, 5, 11-hydrodibenzo [b, f], and [1, 4] thiazepine, The basis which removes one hydrogen atom and is made from 3 ring type condensation benzene rings, such as 10, [b,

e], and 11-dihydro5H-dibenzo [1, 4] diazepine, 1, 2, 3,a [3] and 8, and 8a-hexahydro pyrrolo [2 and 3-b] Indore, is mentioned.

[0033] The above-mentioned formula

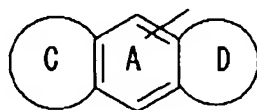
[Chemical formula 10]



Each sign shows the above and this meaning among [type. As an example of a basis expressed with], 1H, [1 and 8-cd], and 3H-naphth [1, 2] OKISAJIN, [1 and 8-naphth de]-1, 3-OKISAJIN, [1 and 8-naphth de]-1, 2-OKISAJIN, 1, 2, 2a, 3, 4, 5-hexahydro BENZU [cd] Indore, 2, 3, 3a, 4, 5, 6-hexahydro 1H-[benzode] Kino Lynne, 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino Lynne, 1, 2 and 5, 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino Lynne, 5, 6-dihydro4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino Lynne, 1H, 5H-[benzoiij] KINORIJIN, AZEPINO [3, 2, and 1-hi] Indore, 1, 2, 4, 5 and 6, 7-hexahydro AZEPINO [3, 2, and 1-hi] Indore, 1H-[3, 2, and 1-pyrid jk] [1] BENZU azepine, 5, 6 and 7, 8-tetrahydro 1H-[3, 2, and 1-pyrid jk] [1] BENZU azepine, 1, 2, 5, 6, 7, 8-hexahydro 1H-[3, 2, and 1-pyrid jk] [1] BENZU azepine, 2, 3-dihydro1H-[BENZU de] iso KINORIN, 1, 2, 3, 4, 4a, 5 and 6, 7-octahydro [1 and 8-naphth bc] azepine, 2 The basis which removes one hydrogen atom and is made from 3 ring type condensation benzene rings, such as 3, 5, 6, 7, and 8-hexahydro 1H-[3, 2, and 1-pyrid jk] [1] BENZU azepine, is mentioned.

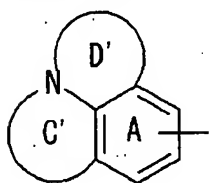
[0034] The above-mentioned formula

[Chemical formula 11]



Each sign shows the above and this meaning among [type. As an example of a basis expressed with], 1, 2, 3, 5, 6, 1, 2-b:4, 7-hexahydro benzo[5-b'] JIPIRORU, The basis which removes one hydrogen atom and is made from 3 ring type condensation benzene rings, such

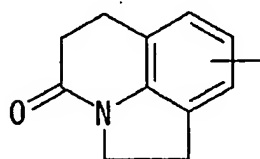
[Chemical formula 14]



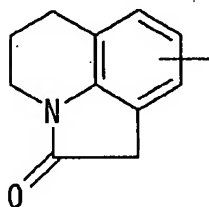
Each sign shows the above and this meaning among [type. The basis expressed with] is still more desirable.

[0037] The same thing as "5 which may be further replaced with the OKISO machine or the nitrogen-containing heterocycle of 9 members" "5 which may be further replaced with the OKISO machine or the nitrogen-containing heterocycle of 9 members" shown with C' ring or a 0037D' ring is indicated to be with B' ring is mentioned. It is a formula especially more preferably.

[Chemical formula 15]



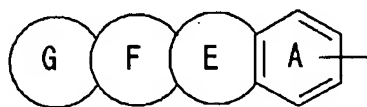
または



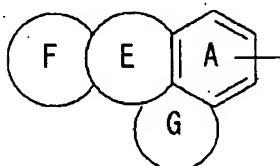
It comes out and the basis expressed is mentioned.

[0038] as an example in case the phenyl group of "this phenyl group may have a substituent by the phenyl group which may be condensed" of the above (3) condenses with 3 ring type heterocycle which may have a substituent -- a formula

[Chemical formula 16]



または

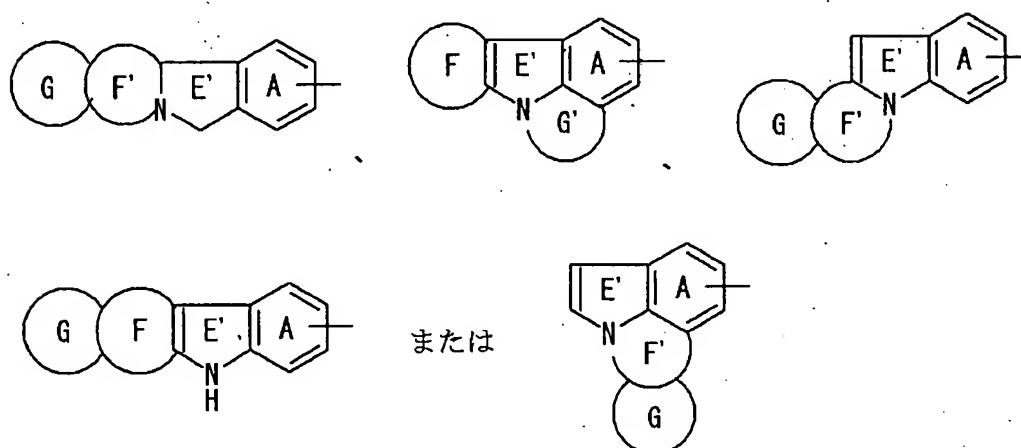


The heterocycle in which, as for A ring, at least one ring of the above, this meaning, E ring, F

ring, and G ring may have a substituent, and other rings show among [type 5 to 9 membered-rings which may have a substituent. The basis expressed with] is mentioned. "The heterocycle which may have a substituent" and "5 to 9 membered-rings which may have a substituent" "the heterocycle which may have a substituent" shown with E ring, F ring, or G ring, and "5 to 9 membered-rings which may have a substituent" are indicated to be with B ring or C ring are mentioned, respectively.

[0039] Among these, it is the (i) type preferably.

[Chemical formula 17]



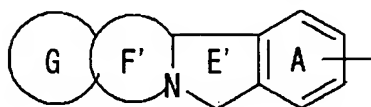
5 by which the above, this meaning, E' ring, and F' ring and G' ring may be further replaced for A ring with the OKISO machine, respectively or the nitrogen-containing heterocycle of 9 members, and --- show a single bond or a double bond among [type. The basis expressed with],

[0040] (ii) For example, a fluoran ten, acephenanthrylene, ASEAN TORIREN, Triphenylene, PIREN, KURISEN, NAFUTASEN, play ADEN, [benzoa] ANTORASEN, Indeno [1 and 2-a] INDEN, cyclo [PENTA a] phenan TOREN, The [pyrid [1', 2':1, 2] imidazo [4 and 5-] b] KINOKI Sarin, The bases which remove one hydrogen atom and are made from rings, such as 1H-2-OKISAPIREN and spiro [*****- 4.9'-KISANTEN], and these dihydroobjects, a tetrahydro object, a hexahydro object, an octahydro object, a DEKAHIDORO object, etc. are mentioned. The same thing as "5 which may be further replaced with the OKISO machine or the nitrogen-containing heterocycle of 9 members" "5 which may be further replaced with the OKISO machine or the nitrogen-containing heterocycle of 9 members" shown with E' ring, F' ring; and

G' ring is indicated to be with B' ring is mentioned.

[0041] The above-mentioned formula

[Chemical formula 18]

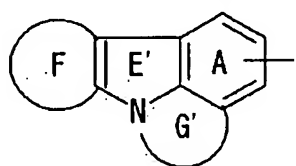


Each sign shows the above and this meaning among [type. As an example of a basis expressed with] two -- H - iso -- indolo -- [-- two -- one - e --] -- a pudding -- one -- H - pyrazolo -- [-- four -- ' -- three -- ' -- : -- three -- four --] -- pyrid -- [-- two -- one - a --] -- isoindole -- one -- H - pyrid -- [-- two -- ' -- three -- ' -- : -- four -- five --] -- imidazo -- [-- two -- one - a --] -- isoindole -- two -- H -- six -- H - pyrid -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- three -- four --] -- imidazo -- [-- five -- one - a --] -- isoindole -- one -- H - iso -- indolo -- [-- two -- one - a --] -- a benzimidazole -- one -- H - pyrid -- [-- three -- ' -- four -- ' -- : -- four -- five --] -- pyrrolo -- [-- two -- one - a --] -- isoindole -- two -- H - pyrid -- [-- four -- ' -- three -- ' -- : -- four -- five --] -- pyrrolo -- [-- two -- one - a --] -- isoindole -- 1H-iso indolo [2 and 1-a] Indore, 2H-iso indolo [1 and 2-a] isoindole, 1H-cyclo PENTA [4, 5] pyrimide [2 and 1-a] isoindole, 2H, 4H - PIRANO[4', 3':4, 5][1, 3]OKISAJINO[2, 3-a] isoindole -- two -- H - iso -- indolo -- [-- two -- one - a --] -- [-- three -- one --] -- benzoxadine -- seven -- H - iso -- indolo -- [-- one -- two - b --] -- [-- one -- three --] -- benzoxadine -- two -- H - pyrid -- [-- two -- ' -- one -- ' -- : -- three -- four --] -- pyrazino -- [-- two -- one - a --] -- isoindole -- pyrid -- [-- two -- ' -- three -- ' -- : -- 4 and 5] pyrimide [2 and 1-a] isoindole and pyrid [3', 2':5, 6] pyrimide -- [-- 2, 1-a] isoindole, and 1H-pyrid [1', 2': 3 and 4] pyrimide [2 and 1-a] isoindole, iso indolo [2 and 1-a] quinazoline, the iso [2 and 1-indolo a] KINOKI Sarin, iso [1 and 2-indolo a] iso KINORIN, iso [2 and 1-indolo b] iso KINORIN, iso [2 and 1-indolo a] Kino Lynne, 6H - OKISAJINO[3', 4': three -- four --] -- [-- one - four --] -- JIAZEPINO -- [-- two -- one - a --] -- isoindole -- AZEPINO -- [-- two -- ' -- one -- ' -- : -- three -- four --] -- pyrazino -- [-- two -- one - a --] -- isoindole -- two -- H -- six -- H - pyrid - [-- two -- ' -- one -- ' -- : -- three -- four --] -- [-- one -- four --] -- JIAZEPINO -- [-- two -- one - a --] -- isoindole -- one -- H - iso -- indolo -- [-- one -- 1, and 2-b][3, 4] benzobird azepine, 1, and 2H-iso [2 and 1-indolo a] [3, 4] benzobird azepine, iso [2 and 1-indolo d] [1, 4] BENZU oxazepine, 1H-iso [2 and 1-indolo b] [2, 4] benzodiazepine, 1H-iso [2 and 1-indolo c] [2, 3] benzodiazepine, 2H-iso [1 and 2-indolo a] [2, 4] benzodiazepine, 2H-iso [2 and 1-indolo d] [1, 4] benzodiazepine, and 5H-indolo [2 and 1-b] -- [-- 3] BENZU azepine, 2H-iso [1 and 2-indolo a] [2] BENZU azepine, 2H-iso [1 and 2-indolo b] [3] BENZU azepine, 2H-iso [2 and 1-indolo b]

[2] BENZU azepine, 2H-iso [1 and 2-indolo b] [1, 3, 4] The basis which removes one hydrogen atom and is made from 4 ring type condensation benzene rings, such as benzoOKISAJI azocine, 1, and iso [2 and 1-indolo b] [2, 6] benzobird azocine, and 5H-UNDESHINO [4 and 8-methano 1H-[1, 5] diaza cyclo] [1 and 11-a] Indore, is mentioned.

[0042] The above-mentioned formula

[Chemical formula 19]

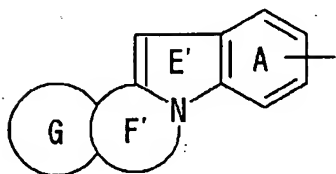


Each sign shows the above and this meaning among [type. As an example of a basis expressed with] 1H and 4H-pyrrolo [3', 2': The [4, 5] [3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino Lynne, pyrrolo [3, 2, and 1-jk] KARUBAZORU, [1H-Flo [2', 3':4, 5] pyrrolo [3, 2, and 1-] ij] Kino Lynne, 1H, and 4H-cyclo PENTA [4, 5] pyrrolo [1, 2, and 3-] de] KINOKI Sarin, 1H, [4H-cyclo PENTA [4, 5] pyrrolo [3, 2, and 1-] ij] Kino Lynne, pyrid [3', 4':4, 5] pyrrolo [1, 2, and 3-de] benzoxadine, [1, 4] OKISAJINO [2, 3, and 4-jk] KARUBAZORU, 1H, and 3H-[1, 3]OKISAJINO[5, 4, 3-jk] KARUBAZORU, pyrid [3', 4': 4, 5] [1, 2, and 3-pyrrolo de] [1, 4] benzothia gin, 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo de] phenan SURIJIN, 4H, 5H-[3, 2, and 1-pyrid de] phenan SURIJIN, 1H, 4H-3a, and 6a-diaza fluoro ANTEN, 1-*****- 4, 6a-diaza fluoro ANTEN, 4-*****- 2, 10b-diaza fluoro ANTEN, 1-****- 4, 6a-diaza fluoro ANTEN, 1H-pyrazino [3, 2, and 1-jk] KARUBAZORU, 1H-[3, 2, and 1-indolo de] [1, 5] NAFUCHI lysine, [Benzob] PIRANO [2, 3, and 4-hi] indolizine, 1H, 3H-[benzob] PIRANO [3, 4, and 5-hi] indolizine, 1H, and [4H-PIRANO [2', 3':4, 5] pyrrolo [3, 2, and 1-] ij] Kino Lynne, 1H, and 3H-benzo[b]CHIOPIRANO[3, 4, 5-hi] indolizine, 1H-pyrid [3, 2, and 1-jk] KARUBAZORU, 4H-3-*****- 11b-azacyclo [hepta-jk] full OREN, 2H-AZEPINO [1', 2':1, 2] PIRIMIJINO [4 and 5-b] Indore, 1H, and 4H-cyclo hepta-[4, 5] pyrrolo -- [-- one -- two -- three - de --] -- KINOKI -- Sarin -- five -- H - pyrid -- [-- three -- ' -- four -- ' -- : -- four -- five --] - - pyrrolo -- [-- one -- two -- three - ef --] -- [-- one -- five --] -- BENZU -- oxazepine -- four -- H - pyrid -- [-- three -- ' -- four -- ' -- : -- four -- five --] -- pyrrolo -- [-- three -- two -- one - jk --] -- [-- four -- one --] -- benzothiazepine -- five -- H - pyrid -- [-- three -- ' -- 4': 4, 5] pyrrolo [1, 2, and 3-ef], and [1, 5] benzothiazepine, 5H-pyrid [4', 3':4, 5] pyrrolo [1, 2, and 3-ef], and [1, 5] benzothiazepine, 1, and [2, 4] bird AZEPINO [6, 5, and 4-jk] KARUBAZORU, 1, and [2, 4] bird AZEPINO[6, 7, 1-jk] KARUBAZORU, [1, 2, 5] Bird AZEPINO [3, 4, and 5-jk] KARUBAZORU, 5H-[1, 4] OKISAZEPINO [2, 3, and 4-jk] KARUBAZORU, 5H-[1, 4] thia ZEPINO [2, 3, and 4-jk]

KARUBAZORU, [1, 4] JIAZEPINO [3, 2, and 1-jk] KARUBAZORU, [1, 4] JIAZEPINO [6, 7, and 1-jk] KARUBAZORU, The basis which removes one hydrogen atom and is made from 4 ring type condensation benzene rings, such as AZEPINO [3, 2, and 1-jk] KARUBAZORU, the [1H-cyclo OKUTA [4, 5] pyrrolo [1, 2, and 3-] de] KINOKI Sarin, and [1H-cyclo OKUTA [4, 5] pyrrolo [3, 2, and 1-] ij] Kino Lynne, is mentioned.

[0043] The above-mentioned formula

[Chemical formula 20]

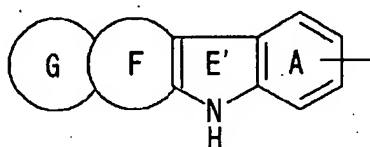


Each sign shows the above and this meaning among [type. As an example of a basis expressed with] one -- H - indolo -- [-- one -- two - a --] -- a benzimidazole -- one -- H - indolo -- [-- one -- two - b --] -- indazole -- pyrrolo -- [-- two -- ' -- one -- ' -- : -- three -- four --] -- pyrazino -- [-- one -- two - a --] -- Indore -- one -- H -- five -- H - pyrrolo -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- four -- five --] -- pyrazino -- [-- one -- two - a --] -- Indore -- 2H-pyrid [2', 3': 3 and 4] pyrrolo [1 and 2-a] Indore, 1H-pyrrolo [2', 3':3, 4] pyrid [1 and 2-a] Indore, 1H-indolo [1 and 2-a] Indore, 6H-iso indolo [2 and 1-a] Indore, 6H-[1 and 2-indolo c] [1, 3] benzoxadine -- one -- H - indolo -- [-- one -- two - b --] -- [-- one -- two --] -- benzo-- thia -- gin -- pyrimide -- [-- four -- ' -- five -- ' -- : -- four -- five --] -- pyrimide -- [-- one -- six - a --] -- Indore -- pyrazino -- [-- two -- ' -- three -- ' -- : -- three -- four --] -- pyrid -- [-- one -- two - a --] -- Indore -- six -- H - pyrid -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- 3 and 4] pyrimide [1 and 6-a] Indore, indolo [1 and 2-b] cinnoline, indolo [1 and 2-a] quinazoline, indolo [1 and 2-c] quinazoline, indolo [2 and 1-b] quinazoline, the [1 and 2-indolo a] KINOKI Sarin, [1 and 2-indolo a] [1, 8] NAFUCHI lysine, [1 and 2-indolo b]-2, 6-NA FUCHIRIJIN, [1 and 2-indolo b] [2, 7] NAFUCHI lysine, [1 and 2-indolo h]-1, 7-NAFUCHI lysine, [1 and 2-indolo b] iso KINORIN, [2 and 1-indolo a] iso KINORIN, [1 and 2-indolo a] Kino Lynne, 2H, and 6H-pyrid [2', 1': 3, 4], and [1, 4] JIAZEPINO [1 and 2-a] Indore, 1H-[2 and 1-indolo c] [1, 4] benzodiazepine, 2H-[1 and 2-indolo d] [1, 4] benzodiazepine, 2H-[2 and 1-indolo a] [2, 3] benzodiazepine, and 2H-indolo [2, 1-b][1, 3] benzodiazepine, 1H-[1 and 2-indolo b] [2]

BENZU azepine, 2H-[1 and 2-indolo a] [1] BENZU azepine, 2H-[2 and 1-indolo a] [2] BENZU azepine, [1 and 2-indolo e] [1, 5] BENZOJI azocine, The basis which removes one hydrogen atom and is made from 4 ring type condensation benzene rings, such as [2 and 1-indolo b] [3] BENZU azocine, is mentioned.

[0044] The above-mentioned formula

[Chemical formula 21]



Each sign shows the above and this meaning among [type. As an example of a basis expressed with] 1H-imidazo [1', 2': one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- one -- H - imidazo -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- one -- six --] -- pyrid -- [-- four -- three - b --] -- Indore -- one -- H - imidazo -- [-- one -- ' -- five -- ' -- : -- one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- one -- H - imidazo -- [-- one -- ' -- five -- ' -- : -- 1 and 6] pyrid [4 and 3-b] Indore, 1H-pyrid [2', 1':2, 3] imidazo [4 and 5-b] Indore, imidazo [4 and 5-a] KARUBAZORU, imidazo [4 and 5-c] KARUBAZORU, pyrazolo [3 and 4-c] KARUBAZORU, and 2H-pyrazino [1 - ' -- 2': 1 and 5] pyrrolo [2 and 3-b] Indore, 1H-pyrrolo [1', 2':1, 2] pyrimide [4 and 5-b] Indore, 1H-in DORIJINO [6 and 7-b] Indore, 1H-in DORIJINO [8 and 7-b] Indore, indolo [2 and 3-b] Indore, Indolo [3 and 2-b] Indore, pyrrolo [2 and 3-a] KARUBAZORU, pyrrolo [2 and 3-b] KARUBAZORU, pyrrolo [2 and 3-c] KARUBAZORU, pyrrolo [3 and 2-a] KARUBAZORU, pyrrolo [3 and 2-b] KARUBAZORU, pyrrolo [3 and 2-c] KARUBAZORU, Pyrrolo [3 and 4-a] KARUBAZORU, pyrrolo [3 and 4-b] KARUBAZORU, pyrrolo [3 and 4-c] KARUBAZORU, [1H-pyrid [3', 4':4, 5] Flo [3 and 2-] b] Indore, 1H-[3 and 4-Flo a] KARUBAZORU, 1H-[3 and 4-Flo b] KARUBAZORU, 1H-[3 and 4-Flo c] KARUBAZORU, 2H-Flo [2, 3-a] KARUBAZORU -- two -- H - Flo -- [-- two -- three - c --] -- KARUBAZORU -- two -- H - Flo -- [-- three -- two - a --] -- KARUBAZORU -- two -- H - Flo -- [-- three -- two - c --] -- KARUBAZORU -- one -- H - pyrid -- [-- three -- ' -- four -- ' -- : -- four -- five --] -- thieno -- [-- two -- three - b --] -- Indore -- thieno -- [-- three -- ' -- two -- ' -- : -- 5 and 6] CHIOPIRANO [4 and 3-b] Indore, thieno [3', 4':5, 6] CHIOPIRANO [4 and 3-b] Indore, 1H-[1] benzothieno [2 and 3-b] Indore, 1H-[1] benzothieno [3 and 2-b] Indore, 1H-thieno [3, 4-a] KARUBAZORU, 2H-thieno [2 and 3-b] KARUBAZORU, 2H-thieno [3 and 2-a] KARUBAZORU, 2H-thieno [3 and 2-b] KARUBAZORU, the [cyclo PENTA [4, 5] pyrrolo [2 and 3-] f] KINOKI Sarin, cyclo PENTA [5, 6] pyrid [2, 3-b] Indore, pyrid [2', 3':3, 4]

cyclo PENTA [1 and 2-b] INDORU, pyrid [2', 3': four -- five --] -- cyclo -- PENTA -- [-- one -- two - b --] -- Indore -- pyrid -- [-- three -- ' -- four -- ' -- : -- three -- four --] -- cyclo -- PENTA -- [-- one -- two - b --] -- Indore -- pyrid -- [-- three -- ' -- four -- ' -- : -- four -- five --] -- cyclo -- PENTA -- [-- one -- two - b --] -- Indore -- pyrid -- [-- four -- ' -- three -- ' -- : -- four -- five --] -- cyclo -- PENTA -- [-- one -- 2-b] Indore, 1H-cyclo PENTA [5, 6] PIRANO [2 and 3-b] Indore, 1H-cyclo PENTA [5, 6] CHIOPIRANO [4 and 3-b] Indore, cyclo PENTA [a] KARUBAZORU, cyclo PENTA [c] KARUBAZORU, indeno [1 and 2-b] Indore, indeno -- [-- two -- one - b --] -- Indore -- [-- one -- two -- four --] -- a bird -- AJINO -- [-- four -- ' -- three -- ' -- : -- one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- one -- three -- five - a bird -- AJINO -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- one -- one --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- one -- H - [-- one -- four --] -- OKISAJINO -- [-- four -- ' -- three -- ' -- : -- one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- one -- H - [-- one -- four --] -- OKISAJINO -- [-- four -- ' -- three -- ' -- : -- one -- six -] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- four -- H - [-- one -- three --] -- OKISAJINO -- [-- three -- ' -- four -- ' -- : -- one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- indolo -- [-- three -- two - b][1 -- 4] Benzoxadine, 1, 3 - OKISAJINO[6, 5-b] KARUBAZORU and 2H-pyrimide [2', 1': two -- three --] -- [-- one -- three --] -- CHIAJINO -- [-- five -- six - b --] -- Indore -- two -- H - [-- one -- three --] -- CHIAJINO -- [-- three -- ' -- two -- ' -- : -- one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- four -- H - [-- one -- three --] -- CHIAJINO -- [-- three -- ' -- four -- ' -- : -- one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- indolo -- [-- two -- three - b][1 -- 4] Benzothia gin, [3 and 2-indolo b] [1, 4] benzothia gin, [3 and 2-indolo c] [2, 1] benzothia gin, 1, and 4-CHIAJINO [2 and 3-a] KARUBAZORU, [1, 4] CHIAJINO [2 and 3-b] KARUBAZORU, [1, 4]CHIAJINO[2, 3-c] KARUBAZORU, 1, and 4-CHIAJINO [3 and 2-b] KARUBAZORU, 1, and 4-CHIAJINO [3 and 2-c] KARUBAZORU, 1H-indolo [2 and 3-g] PUTERIJIN, 1H-indolo [3 and 2-g] PUTERIJIN, pyrazino [1', 2': one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- pyrazino -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- one -- two --] -- pyrid -- [-- four -- three - b --] -- Indore -- one -- H - pyrid -- [-- two -- ' -- three -- ' -- : -- five -- six --] -- pyrazino -- [-- two -- three - b --] -- Indore -- one -- H - pyrid -- [-- three -- ' -- two -- ' -- : -- five -- six --] -- pyrazino -- [-- two -- three - b --] -- Indore -- 1H-pyrid [3', 4':5, 6] pyrazino [2 and 3-b] Indore, pyrid [1', 2': one -- two --] -- pyrimide -- [-- four -- five - b --] -- Indore -- pyrid -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- one -- two --] -- pyrimide -- [-- five -- four - b --] -- Indore -- pyrid -- [-- two -- ' -- one -- ' -- : -- two -- three --] -- pyrimide -- [-- four -- five - b --] -- Indore -- pyrimide -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- Pyrimide [1', 2': one -- six --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- pyrimide -- [-- five -- ' -- four -- ' -- : -- five -- six --] -- PIRANO -- [-- two -- three - b --] -- Indore -- pyridazino -- [-- four -- ' -- five -- ' -- : -- five -- six --] -- CHIOPIRANO -- [-- four -- five - b --] -- Indore -- one -- H - indolo -- [-- three -- two - c --] -- cinnoline -- one -- H - indolo -- [-- two -- 3-b] KINOKI Sarin, 1H-pyrazino [2 and 3-a] KARUBAZORU, 1H-pyrazino [2 and 3-b] KARUBAZORU, 1H-pyrazino [2

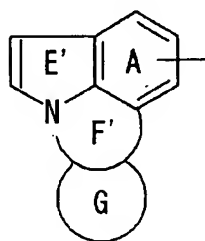
and 3-c] KARUBAZORU, 1H-pyridazino [3 and 4-c] KARUBAZORU, 1H-pyridazino [4 and 5-b] KARUBAZORU, 1H-pyrimide [4 and 5-a] KARUBAZORU, 1H-pyrimide [4 and 5-c] KARUBAZORU, 1H-pyrimide [5 and 4-a] KARUBAZORU, 1H-pyrimide [5 and 4-b] KARUBAZORU, 1H-pyrimide [5 and 4-c] KARUBAZORU, 7H-1, 4 - JIOKISHINO[2', 3': 5, 6], and [1, 2] JIOKISHINO [3 and 4-b] Indore, 6H-[1, 4] benzoJIOKISHINO [2 and 3-b] Indore, 6H-[1, 4] benzoJICHIINO [2 and 3-b] Indore, 1H-[2 and 3-indolo b]-1, 5-NAFUCHI lysine, and 1H-indolo [2, 3-b][1, 6] NAFUCHI lysine, 1H-[2 and 3-indolo b] [1, 8] NAFUCHI lysine, 1H-[2 and 3-indolo c]-1, 5-NAFUCHI lysine, 1H-[2 and 3-indolo c] [1, 6] NAFUCHI lysine, 1H-[2 and 3-indolo c] [1, 7] NAFUCHI lysine, 1H-[2 and 3-indolo c] [1, 8] NAFUCHI lysine, 1H-[3 and 2-indolo b]-1, 5-NAFUCHI lysine, 1H-[3 and 2-indolo b] [1, 7] NAFUCHI lysine, 1H-[3 and 2-indolo b] [1, 8] NAFUCHI lysine, 1H-[3 and 2-indolo c] [1, 8] NAFUCHI -- lysine -- indolo -- [-- two -- three - a --] -- KINORIJIN -- indolo -- [-- two -- three - b --] -- KINORIJIN -- indolo -- [-- three -- two - a --] -- KINORIJIN -- indolo -- [-- three -- two - b --] -- KINORIJIN -- PIRANO -- [-- four -- ' -- three -- ' -- : -- five -- six --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- pyrid -- [-- four -- ' -- three -- ' -- : -- 4 5]PIRANO[3 2-b] Indore, pyrid [4', 3': 5 and 6] PIRANO [2 and 3-b] Indore, pyrid [4', 3': 5 and 6] PIRANO [3 and 4-b] Indore, 1H-[2 and 3-indolo c] iso KINORIN, 1H-[3 and 2-indolo c] iso KINORIN, 1H-[2 and 3-indolo c] Kino Lynne, 1H-[3 and 2-indolo c] Kino Lynne, 1H-pyrid [2 and 3-a] KARUBAZORU, 1H-pyrid [2 and 3-b] KARUBAZORU, 1H-pyrid [2 and 3-c] KARUBAZORU, 1H-pyrid [3 and 2-a] KARUBAZORU, 1H-pyrid [3 and 2-b] KARUBAZORU, 1H-pyrid [3 and 2-c] KARUBAZORU, 1H-pyrid [3 and 4-a] KARUBAZORU, 1H-pyrid [3 and 4-b] KARUBAZORU, 1H-pyrid [3 and 4-c] KARUBAZORU, 1H-pyrid [4 and 3-a] KARUBAZORU, 1H-pyrid [4 and 3-b] KARUBAZORU, 1H-pyrid [4 and 3-c] KARUBAZORU, 1H-KINDORIN, 1H-quinine drine compounds, 1H-PIRANO [3', 4':5, 6] PIRANO [4 and 3-b] Indore, [1] benzoPIRANO [2 and 3-b] Indore, [1] benzoPIRANO [3 and 2-b] Indore, [1] benzoPIRANO[3, 4-b] Indore, [1] benzoPIRANO [4 and 3-b] Indore, [2] benzoPIRANO [4 and 3-b] Indore, PIRANO [2 and 3-a] KARUBAZORU, PIRANO [2 and 3-b] KARUBAZORU, PIRANO [2 and 3-c] KARUBAZORU, PIRANO[3, 2-a] KARUBAZORU, PIRANO [3 and 2-c] KARUBAZORU, PIRANO [3 and 4-a] KARUBAZORU, 1H-HOSUFINORINO [4 and 3-b] Indore, [1] benzoCHIOPIRANO [2 and 3-b] Indore, [1] benzoCHIOPIRANO [3 and 2-b] Indore, [1] BenzoCHIOPIRANO [3 and 4-b] Indore, [1] benzoCHIOPIRANO [4 and 3-b] Indore, [2] benzoCHIOPIRANO [4 and 3-b] Indore, 1H-[benzoa] KARUBAZORU, 1H-[benzob] KARUBAZORU, 1H-[benzoc] KARUBAZORU, [1, 6, 2] OKISACHIAZEPINO[2', 3': one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- one -- H - AZEPINO -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- one -- H - pyrid -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- one -- two --] -- AZEPINO -- [-- four -- five - b --] -- Indore -- two -- H - pyrid -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : 1 and 2]AZEPINO[3 -- 4-b] Indore and 1H-pyrid [3', 2': five -- six --] -- OKISEPINO -- [-- three -- two - b --] -- Indore -- one -- H - pyrid -- [-- four -- ' -- three -- ' -- : --

five -- six --] -- OKISEPINO -- [-- three -- two - b --] -- Indore -- two -- H - pyrid -- [-- two -- ' -- three -- ' -- : -- five -- six --] -- OKISEPINO -- [-- two -- three - b --] -- Indore -- two -- H - pyrid -
 - [-- two -- ' -- three -- ' -- : -- five -- six --] -- OKISEPINO -- [-- three -- two - b --] -- Indore -- two -- H - pyrid -- [-- three -- ' -- four -- ' -- : -- five -- six --] -- OKISEPINO -- [-- three -- two - b --] -- Indore -- pyrid -- [-- two -- ' -- three -- ' -- : -- four -- five --] -- cyclo -- hepta--- [-- one -- two - b --] -- Indore -- pyrid -- [-- three -- ' -- two -- ' -- : -- three -- four --] -- cyclo -- hepta--- [-- one -- 2-b] Indore, pyrid [3', 4': four -- five --] -- cyclo -- hepta--- [-- one -- two - b --] -- Indore -
 - pyrid -- [-- three -- ' -- four -- ' -- : -- five -- six --] -- cyclo -- hepta--- [-- one -- two - b --] -- Indore -- two -- H - PIRANO -- [-- three -- ' -- two -- ' -- : -- two -- three --] -- AZEPINO -- [-- four -- five - b --] -- Indore -- one -- H - indolo -- [-- three -- two - b --] -- [-- one -- five --] -- BENZU -- oxazepine -- 1H-[3 and 2-indolo d] [1, 2] BENZU oxazepine, 1H-indolo [2 and 3-c], and [1, 5] benzothiazepine, [1, 4] JIAZEPINO [2 and 3-a] KARUBAZORU, [2 and 3-indolo b] [1, 5] benzodiazepine, [2 and 3-indolo d] [1, 3] Benzodiazepine and indolo [3 2-b][1, 4] benzodiazepine, [3 and 2-indolo b] [1, 5] benzodiazepine, [3 and 2-indolo d] [1, 3] benzodiazepine, [3 and 2-indolo d] [2, 3] benzodiazepine, [2 and 3-indolo a] [3] BENZU azepine, [2 and 3-indolo c] [1] BENZU azepine, [2 and 3-indolo d] [1] BENZU azepine, [2 and 3-indolo d] [2] BENZU azepine, [3 and 2-indolo b] [1] BENZU azepine, [3 and 2-indolo c] [1] BENZU azepine, indolo [3, 2-d][1] BENZU azepine, 1H-[2 and 1-indolo b] [3] BENZU azepine, 1H-[1] BENZUOKISEPINO [5 and 4-b] Indore, 1H-[2] BENZUOKISEPINO [4 and 3-b] Indore, 1H-[1] benzoCHIEPINO [4 and 5-b] Indore, 1H-[1] benzoCHIEPINO [5 and 4-b] Indore, benzo [3, 4] cyclo [1 and 2-hepta-b] Indore, benzo[4, 5] cyclo [1 and 2-hepta-b] Indore, benzo[5, 6] cyclo [1 and 2-hepta-b] Indore, benzo[6, 7] Cyclo [1 and 2-hepta-b] Indore, cyclo [hepta-b] Culver ZORU, 4H-[1, 5] OKISAZOSHINO [5', 4':1, 6] pyrid [3 and 4-b] Indore, and AZOSHINO -- [1', 2': one -- two --] -- pyrid -- [-- three -- four - b --] -- Indore -- two -- six - methano -- two - H - AZESHINO -- [-- four -- three - b --] -- Indore -- three -- seven - methano -- three -- H - AZESHINO -- [-- five -- four - b --] -- Indore -- pyrid -- [-- one -- ' -- two -- ' -- : -- one -- eight --] -- AZOSHINO -- [-- five -- four - b --] -- Indore -- pyrid -- [-- four -- ' -- three -- ' -- : -- 6 and 7] OKISOSHINO [2 and 3-b] Indore, pyrid [4', 3':6, 7] OKISOSHINO [4 and 3-b] Indore, 1, and 5-methano 1H-AZESHINO [3 and 4-b] Indore, 2, and 6-methano 1H-AZESHINO [5 and 4-b] Indore and 1H-pyrid [3 -- ' -- 4': 5 and 6] cyclo OKUTA [1 and 2-b] Indore, 1, and 4-ETANOOKISOSHINO [3 and 4-b] Indore, PIRANO [3', 4':5, 6] cyclo OKUTA [1 and 2-b] Indore, 1, and 1H-[2 and 3-indolo c] [2, 5, 6] benzoetra-ZOSHIN, 1H-[2 and 3-indolo c] [1, 6] BENZOJl azocine, 6, and 13b-methano 13bH-AZESHINO [5 and 4-b] Indore, OKISOSHINO [3 and 2-a] KARUBAZORU, 1H-[benzog] cyclo OKUTA [b] Indore, 6, 3- (IMINO methano)-2H-ZONINO [1 and 4-thia] [9 and 8-b] Indaw RU, 1H, and 3H-[1, 4]OKISAZONINO[4', 3': 1 and 2] pyrid [3 and 4-b] Indore, 2H-ETANOAZONINO [3 and 6-] [5 and 4-b] Indore, 2H-UNDESHINO [3 and 7-methano azacyclo] [5 and 4-b] Indore, 1H-ETANOAZONINO [6 and 12b-] [5 and 4-b] Indore,

indolo [3, 2-e] and [2] BENZUAZONIN, 5, and 9-methano azacyclo UNDESHINO [5 and 4-b] Indore, 3, and 6-Etah Nor 3H-AZESHINO [5 and 4-b] Indore, 3, and 7-methano 3H-azacyclo UNDESHINO [5 and 4-b] Indore, PIRANO[4', 3': 8 and 9] AZESHINO [5 and 4-b] Indore, 1H-[2 and 3-indolo c] [1, 7] benzoJIAZESHIN, 1H-indolo [3 and 2-e] and [2] BENZUAZESHIN, [benzoe] pyrrolo [3 and 2-b] Indore, [benzoe] pyrrolo [3 and 2-g] Indore, [Benzoe] pyrrolo [3, 2, and 1-hi] Indore, [benzoe] pyrrolo [3 and 4-b] Indore, [benzog] pyrrolo [3 and 4-b] Indore, 1H-[benzof] pyrrolo [1 and 2-a] Indore, 1H-[benzog] pyrrolo [1 and 2-a] Indore, 2H- [Benzoe] pyrrolo [1 and 2-a] Indore, 1H-[benzof] pyrrolo [2 and 1-a] isoindole, 1H-[benzog] pyrrolo [2 and 1-a] isoindole, 2H-[benzoe] pyrrolo [2 and 1-a] isoindole, and iso indolo [6, 7, Cyclo *****- 1, 1-cde] Indore and spiro [5' pyrrolo [-[5H]] [2 and 1-a] isoindole] iso [7, 1, and 2-indolo hij] Kino Lynne, 7, and 11-methano AZOSHINO [1 and 2-a] Indore, 7, 11-methano AZOSHINO[2, 1-a] Isoindole, JIBENZU [cd, f] Indore, JIBENZU [cd, g] Indore, JIBENZU [d, f] Indore, 1H-JIBENZU [e, g] Indore, 1H-JIBENZU [e, g] isoindole, [1, 2, and 3-naphth cd] Indore, [1 and 8-naphth ef] Indore, [1 and 8-naphth fg] Indore, [3, 2, and 1-naphth cd] Indore, 1H-[1 and 2-naphth e] Indore, 1H-[1 and 2-naphth f] Indore, 1H-[1 and 2-naphth g] Indore, 1H-naphth [2, 1-e] Indore, 1H-[2 and 3-naphth e] Indore, and 1H-naphth -- [-- one -- two - f --] -- isoindole -- one -- H - naphth one -- [-- two -- three - e --] -- isoindole -- spiro -- [-- one -- H - Culver -- *****- -- one - one -- ' - cyclo -- HEKISAN --] -- spiro -- [-- two -- H - Culver -- *****- -- two -- one -- ' - cyclo -- HEKISAN --] -- spiro -- [-- three -- H - Culver -- *****- -- three -- one -- ' - cyclo -- HEKISAN --] -- [Cyclo hepta-[4, 5] pyrrolo [3 and 2-] f] Kino Lynne, [cyclo hepta-[4, 5] pyrrolo [3 and 2-] h] Kino Lynne, AZEPINO [4 and 5-b] BENZU [e] Indore, 1H-AZEPINO [1 and 2-a] BENZU [f] Indore, 1H - AZEPINO[2, 1-a] The basis which removes one hydrogen atom and is made from 4 ring type condensation benzene rings, such as BENZU [f] isoindole, [benzoe] cyclo [hepta-b] Indore, and [benzog] cyclo [hepta-b] Indore, is mentioned.

[0045] The above-mentioned formula

[Chemical formula 22]

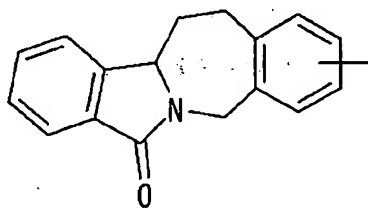


Each sign shows the above and this meaning among [type. As an example of a basis

expressed with] 1H - JIPIRORO[2 and 3-b : 3, 2, 1'-hi] Indore, spiro [cyclo pen ****- 1, 2 '(1'H) - pyrrolo [3, 2, and 1-hi] Indore] and spiro [imidazolidine 4 and 1' (2'H)-[4H] [3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino Lynne], and pyrid [2 and 3-b] pyrrolo [3, 2, 1-hi] Indore, pyrid [4 and 3-b] pyrrolo [3, 2, and 1-hi] Indore, [benzode] [3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino Lynne, 3H-pyrrolo [3, 2, and 1-de] AKURIJIN, 1H-pyrrolo [3, 2, and 1-de] phenanthridine, spiro -- [Cyclo *****- 1, 6 '-[6H] [3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino Lynne], 4, 9-methano [3, 2, and 1-pyrrolo lm] [1] benzoazocine, and spiro [cycloheptane 1 and 6'-[6H] [3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino Lynne], and 1H - PIRANO[3 -- 4-d] [3, 2, and 1-pyrrolo jk] [1] BENZU azepine, 3H-[benzob] [3, 2, and 1-pyrrolo jk] [4, 1] BENZU oxazepine, 7H-[1 and 7-indolo ab] [4, 1] BENZU oxazepine, [benzob] [3, 2, and 1-pyrrolo jk] [1, 4] Benzodiazepine, Inn [1 and 7-Dollo ab] [1, 4] benzodiazepine, [1 and 7-indolo ab] [1] BENZU azepine, [7 and 1-indolo.ab] [3] BENZU azepine, 1H-cyclo [hepta-d] [3, 2, and 1-jk] [1] BENZU azepine, spiro [AZEPINO[3, 2, 1-hi] Indore 7 (4H), 1'-cycloheptane], 4H-5, 11-methano [3, 2, and 1-pyrrolo no] [1] BENZUAZASHI clone crepe de Chine, spiro [AZEPINO [3, 2, and 1-hi] Indore 7 (4H), The basis which removes one hydrogen atom and is made from 4 ring type condensation benzene rings, such as 1'-cyclo OKUTAN], is mentioned.

[0046] Among these, it is a formula still more preferably.

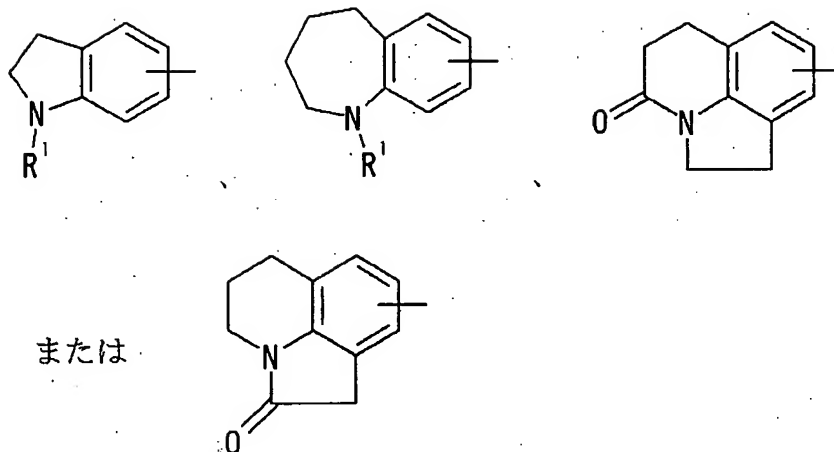
[Chemical formula 23]



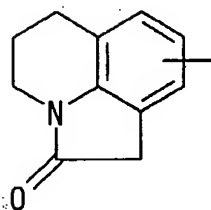
It is the basis come out of and expressed.

[0047] the formula which is shown by Ar and which may have a substituent preferably as "this phenyl group may have a substituent by the phenyl group which may be condensed", for example

[Chemical formula 24]

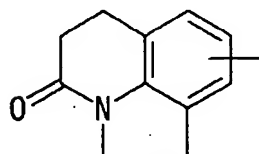


または



It is the basis come out of and expressed. It is a formula especially preferably.

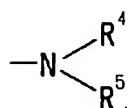
[Chemical formula 25]



It is the basis come out of and expressed.

[0048] n is the integer of 1 to 6 preferably. Furthermore, it is 2 to 6 preferably. It is 2 especially preferably. R and R' may show the hydrocarbon group which may have a hydrogen atom, a halogen atom, or a substituent, respectively, and may differ in the repetition of n . As a "halogen atom" shown by R and R' , fluoride, chlorine, bromine, iodine, etc. are mentioned and fluoride is especially desirable. The thing same as "a hydrocarbon group which may have a substituent" shown by R and R' as "the hydrocarbon group which may have a substituent" shown by R_1 is mentioned. As R and R' , a hydrogen atom or fluoride is desirable. As R and R' , a hydrogen atom is still more desirable. As "an amino group which may be replaced" shown by Y , it is a formula, for example.

[Chemical formula 26]

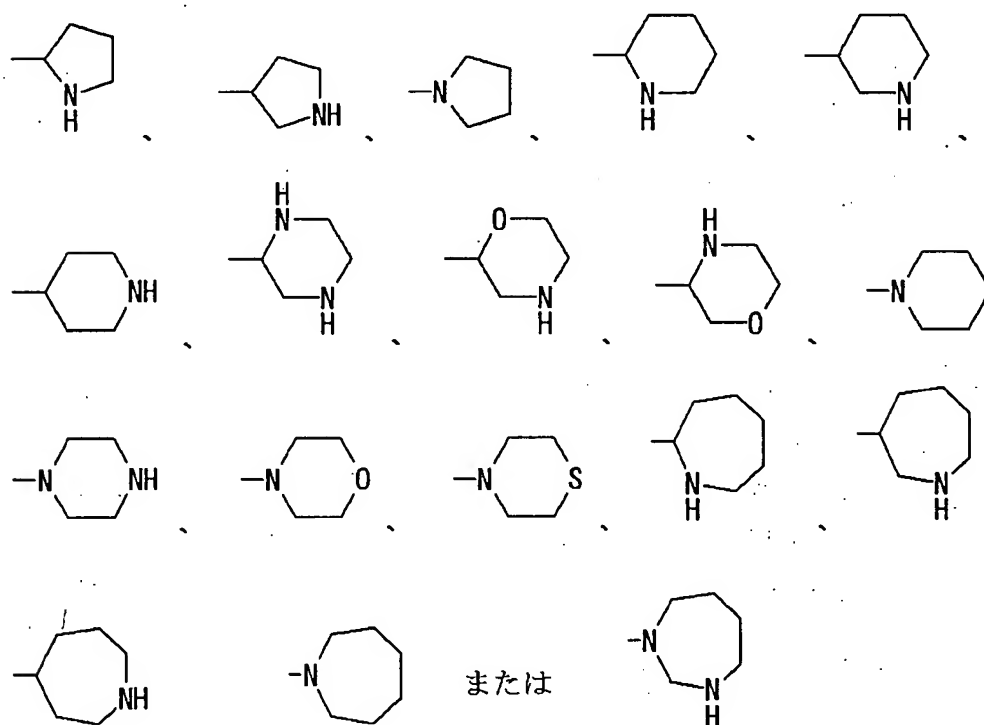


R_4 and R_5 show among [type the hydrocarbon group or acyl group which may have a

hydrogen atom and a substituent, respectively. The basis expressed with] is mentioned. The thing same as "the hydrocarbon group which may have a substituent" shown by R4 or R5, and an "acyl group" as "the hydrocarbon group which may have a substituent" and the "acyl group" which are shown by R1 is mentioned.

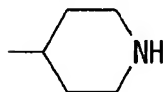
[0049] As a "nitrogen-containing saturation heterocyclic machine" of the "nitrogen-containing saturation [which may have a substituent] heterocyclic machine" shown by Y 5 to 9 member (preferably 5 or 7 members) nitrogen-containing saturation heterocyclic machine which may contain 1 to 3 hetero atoms chosen from a nitrogen atom, an oxygen atom, and a sulfur atom in addition to a carbon atom and one nitrogen atom is mentioned. Specifically, it is a formula.

[Chemical formula 27]



It comes out and the basis expressed is mentioned. Among these, it is 6 membered-ring machine preferably. furthermore -- desirable

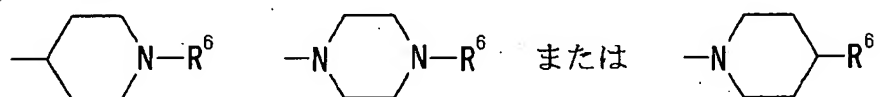
[Chemical formula 28]



it comes out.

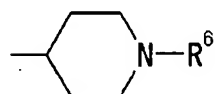
[0050] The thing same as a "substituent" of ** "nitrogen-containing saturation heterocyclic machine which may have a substituent" as the "substituent" of "the heterocycle which may have a substituent" shown with the above-mentioned B ring is mentioned, and the number of substituents is 1 to 5 pieces. Moreover, the nitrogen of the "nitrogen-containing saturation heterocyclic machine" of ** "nitrogen-containing saturation heterocyclic machine which may have a substituent" may have the same thing as the basis expressed with the above R1. As Y, it is a formula preferably.

[Chemical formula 29]



R6 shows R1 and this meaning among [type. It is the basis expressed with]. Furthermore, it is a formula preferably.

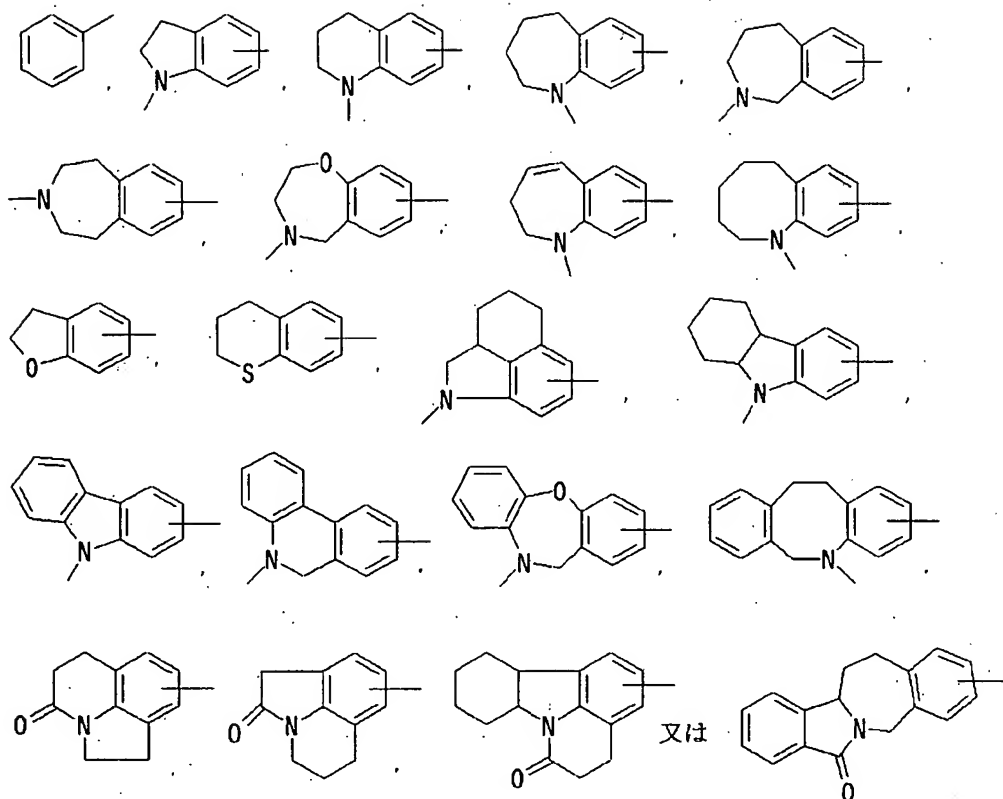
[Chemical formula 30]



R6 shows the above and this meaning among [type. It is the basis expressed with]. R6 is the hydrocarbon group which may have a hydrogen atom or a substituent preferably. Preferably Furthermore, halogen atoms (preferably fluoro etc.), C1-6 ARUKIRU (preferably MECHIRU etc.), It is the C7-16 ARARUKIRU machine (preferably Ben Jill) which may have 1 to 3 substituents chosen from C1-6 alkoxy (preferably METOKISHI etc.), cyano, nitroglycerine, and HIDOROKISHI.

[0051] As a compound (I), Ar is a formula preferably.

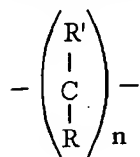
[Chemical formula 31]



Come out, and when it is the basis expressed, among these Ar is a phenyl group, this phenyl group (i) halogen (fluoro etc.), (ii) -- C1-6 alkoxy (METOKISHI etc.) and amino (iii) ** (iv) (mono-**** is JI) C1-6 alkylamino (methylamino --) (v) pyrrolidino, such as ethylamino, dimethylamino, and diethylamino, (vi) Piperidino, piperazino (vii), N(viii)-MECHIRU piperazino, N- (ix) -- [, and] (xi) HEKISA methylene / ASECHIRU piperazino, (x) morpholino, and] (xii) You may have the substituent chosen from C1-6 ARUKIRU (pro pill etc.) which may be replaced by KARUBOKISHI which may be etherified by imidazolyl and (xiii) C1-6 ARUKIRU (MECHIRU etc.),

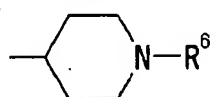
[0052] When it is the phenyl group which Ar condensed, the heterocyclic portion is (1) C1-6 ARUKIRU ([MECHIRU and]), (2) halogen, such as ethyl, a pro pill, and n-butyl (a fluoro, chloro, etc.), C7-16 ARARUKIRU (Ben Jill --) which may have the substituent chosen from C1-6 ARUKIRU (MECHIRU etc.), C1-6 alkoxy (METOKISHI etc.), and nitroglycerine (3)[, such as phenylethyl,] C1-6 Al ****- Calvo Nils ([ASECHIRU and]) (4) C7-16 *****- Calvo Nils, such as pro PIONIRU, iso BUCHIRIRU, and pivaloyl (phenylacetyl etc.), (5) C6-14 Ali Lou Calvo Nils (BENZOIRU etc.) and (6) C1-6 Al ****- Calvo ****- C6-14 ARIRU (methylbenzoyl etc.), (7) you may have the substituent chosen from C1-6 alkoxy *****- C6-14 ARIRU (METOKISHIBENZOIRU etc.) and (8) pyridyl --; n -- 2; R and R' -- respectively -- hydrogen atom or fluoride (preferably hydrogen atom); -- namely

[Chemical formula 32]



** -CH₂CH₂-, -CHFCH₂-, or CF₂CH₂-; Y is a formula.

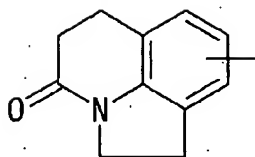
[Chemical formula 33]



The sign in [type shows the above and this meaning. R₆ by the basis expressed with] (1) hydrogen atom, (2) cyano, hydroxy ** (mono-**** is JI) C1-6 alkylamino (diethylamino etc.), C1-6 ARUKIRU which may have the substituent chosen from pyridyl and KARUBOKISHI which may be etherified (with C1-6 ARUKIRU (ethyl etc.)) ([MECHIRU and]) (3) halogen (a fluoro, chloro, etc.), such as ethyl and an iso pro pill, C1-6 ARUKIRU ([MECHIRU and]) Halogeno C1-6 ARUKIRU, such as t-butyl (trifluoromethyl etc.), Hydroxy ** C1-6 alkoxy (METOKISHI etc.), nitroglycerine, and amino ** C1-6 alkoxy (OCH₂CO₂H --) which may be replaced by cyano, Culver Moyle, and KARUBOKISHI by which you may be etherified (C1-6 ARUKIRU etc.) Amino which may be replaced by Culver Moyle or HORUMIRU by which OCH₂CO₂Et etc. may be replaced by C1-6 ARUKIRU ([NHCHO and]) C7-16 ARARUKIRU which may have the substituent chosen from C1-3 alkylene dioxy (methylene dioxy etc.), such as NHCONH₂ and NHCONHMe, (Ben Jill, alpha-methylbenzyl, phenylethyl, etc.), C1-6 ARUKIRU which may be replaced by KARUBOKISHI of which (4) (C1-6 ARUKIRU (ethyl etc.) etc.) etherification may be done ([MECHIRU and]) The compound which are C1-6 Al ****- Calvo Nils (ASECHIRU etc.) who may be replaced by (5) (mono-**** is JI) C1-6 alkylamino (dimethylamino etc.), such as a pro pill, is mentioned.

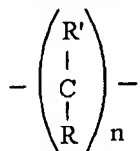
[0053] As a compound (I), Ar is a formula still more preferably.

[Chemical formula 34]



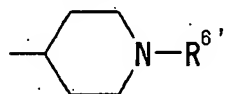
basis; n come out of and expressed -- 2; R and R' -- respectively -- hydrogen atom or fluoride (preferably hydrogen atom); -- namely

[Chemical formula 35]



--CH₂CH₂-, -CHFCH₂-, or CF₂CH₂-; Y is a formula.

[Chemical formula 36]



R6' shows among [type 1 or Ben Jill who may have two pieces for the substituent chosen from a halogen atom, C1-3 ARUKIRU, C1-3 alkoxy ** cyano, nitroglycerine, and HIDOROKISHI. The compound which is the basis expressed with] is mentioned.

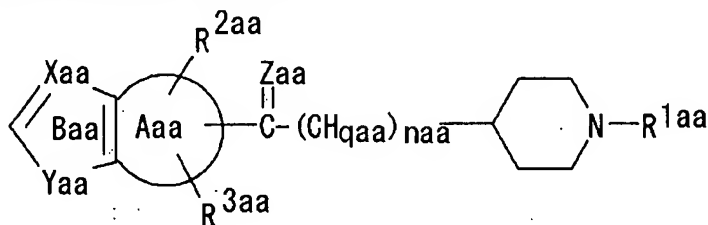
[0054] Preferably especially 8-[3-[1-[(3-fluoro phenyl) MECHIRU]-4-piperidiny]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON, 8-[3-[1-(phenylmethyl)-4-piperidiny]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON, 8-[3-[1-[(2-hydroxyphenyl) MECHIRU]-4-piperidiny]-1-OKISO pro pill]-1, 2 and 5, 6-tetrahydro 4H-[3, 2, and 1-pyrrolo ij] Kino ****- 4-ON, eight - [-- two - a fluoro -- three - [-- one - [(3-fluoro phenyl) -- MECHIRU --] -four - piperidiny one --] -one - OKISO -- a pro -- a pill --] - one -- two -- five -- six - tetrahydro one -- four -- H - pyrrolo -- "-- three -- two -- one - ij --] -- Kino -- ****- -- four - ON -- or -- the -- salt -- etc. -- mentioning -- having -- although -- The crystal of this invention is the most suitable from the field of the stability of an active ingredient, or validity.

[0055] a compound (I) or its salt -- the very thing -- it can manufacture by the method according

to a well-known method or well-known it. "Specifically, it is shown by (1) Ar among the above-mentioned formula. It is the phenyl group which may be condensed. When that this phenyl group may have a substituent" does not form a condensed ring, It is shown by (2) Ar, such as a method JP,H3-173867,A (EP-A-0378207 No.) and given in a JP,64-79151,A number (EP-A-0296560 No.). "[the phenyl group which may be condensed] When condensing with the monocycle type heterocycle in which that this phenyl group may have a substituent" may have a substituent, JP,H5-140149,A (EP-A-0487071 No.), JP,H6-166676,A (EP-A-0560235 No.), It is shown by (3) Ar, such as a method JP,H6-206875,A (EP-A-0567090 No.) and given in JP,H2-169569,A (USP No. 4,895,841). "[the phenyl group which may be condensed] When condensing with 2 ring type heterocycle in which that this phenyl group may have a substituent" may have a substituent, When condensing with two same or different monocycles (however, at least one ring is monocycle type heterocycle), or a method given in JP,H7-206854,A (EP-A-0607864 No.) etc., And when condensing with 3 ring type heterocycle which is shown by (4) Ar and in which "this phenyl group may have a substituent by the phenyl group which may be condensed" may have a substituent, What is necessary is just to manufacture an object according to a method given in JP,7-309835,A (EP-A-0655451 No.) etc.

[0056] 2) Formula

[Chemical formula 37]

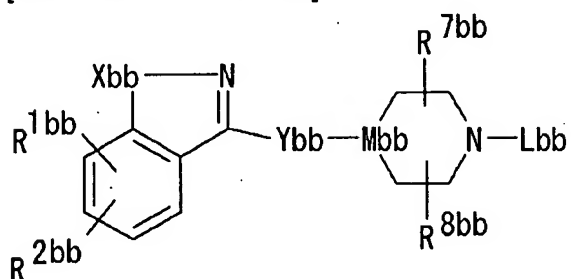


Among the side chain which contains C=Zaa among [type, R2aa, or R3aa, [one] Combine with the carbon atom shown by * of Ring Baa, and Ring Aaa shows benzo, thieno, pyrid, pyrazino, pyrimide, flannel, seleno one, pyrrolo, CHIAZORO, or imidazolo. R1aa is phenyl and phenyl C1-6 ARUKIRU, SHINNAMIRU, or heteroaryl MECHIRU ([here] as a heteroaryl machine). imidazolo, CHIAZORO, thieno, pyrid, or iso oxazolo -- being shown -- it may be shown and the phenyl and the heteroaryl machine may have 1-2 substituents chosen from C1-6 ARUKIRU and C1-6 alkoxy ***** halogen. R2aa and R3aa become independent, respectively, and Hydrogen atom and C1-6 alkoxy ** The C1-6 alkyl group which may be replaced with 1-3 fluoride, [show / benzyloxy one, a hydroxy , phenyl, Ben Jill, halogen, nitroglycerine, cyano, COOR4aa, CONHR4aa NR4aaR5aa, NR4aaCOR5aa, or SOpaaCH2Ph

(paa shows 0, 1, or 2 here)] R2aa and R3aa may form 5 to 6 membered-rings (the composition atoms of a ring are carbon, nitrogen, and oxygen), for example, methylene dioxy, ethylene dioxy, or a RAKUTAMU ring with an adjoining carbon atom. Moreover, [show / independently / R4aa and R5aa / , respectively / a hydrogen atom or C1-6 alkyl group] R4aa of NR4aaR5aa and R5aa may form 4 to 8 membered-rings (other composition atoms of a ring are carbon, oxygen, or nitrogen.) which contain at least one nitrogen atom with an adjoining nitrogen atom. Moreover, R4aa of NR4aaCOR5aa and R5aa may form 4 to 8 member RAKUTAMU ring with an adjoining nitrogen atom and an adjoining carbon atom. Xaa shows nitrogen or CH and Yaa shows oxygen, sulfur, or NR6aa. R6aa shows a hydrogen atom, C1-6 ARUKIRU, CO-C1-6 ARUKIRU, or SO2-phenyl (here, the phenyl group may have 1 to 5 substituents chosen independently of C1-4 ARUKIRU). As for each qaa, in naa, Zaa shows [the integer of 1 to 4] oxygen or sulfur independently for 1 to 2. The compound expressed with], or its salt. As an example, 1-(2-*****- 1H-benzimidazole 5-IRU)-3-[1-(phenylmethyl)-4-piperidiny]-1-pro PANON, 1-(6-MECHIRU [benzob] ****- 2-IRU)-3-[1-(phenylmethyl)-4-piperidiny]-1-pro PANON, 1-(6-methylindole 2-IRU)-3-[1-(phenylmethyl)-4-piperidiny]-1-pro PANON, etc. are mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to the method of WO 93/07140 description, or it.

[0057] 3) Formula

[Chemical formula 38]

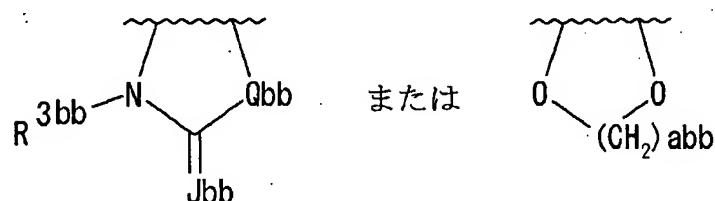


R1bb and R2bb among [type, respectively Hydrogen atom and C1-6 alkoxy ** Benzyloxy one, FENOKISHI, a hydroxy ** phenyl, Ben Jill, halogen, Nitroglycerine, cyano, formula:COR5bb, -COOR5bb, -CONHR5bb, - NR5bbR6bb or a NR5bbCOR6bb (inside of formula, R5bb, and R6bb are i, respectively) hydrogen atom, ii) C1-6 ARUKIRU, iii halogen, C1-4 ARUKIRU, trifluoromethyl, R5bb of 1, the phenyl which you may have two pieces, respectively, Ben Jill;, or NR5bbR6bb, and R6bb become together about the substituent chosen from C1-4 alkoxy ** cyano, nitroglycerine, and HIDOROKISHI, and 4 to 8 member nitrogen ring is formed. R5bb of NR5bbCOR6bb and R6bb become together -- 4 to 8 member RAKUTAMU ring -- forming --

the basis expressed -- C1-6 ARUKIRU which may be replaced with 1 to 3 fluoride, and formula: SOpbbCH₂-phenyl or -- the basis expressed with SOpbbC1-6 ARUKIRU (pbb shows 0, 1, or 2 among a formula), pyridyl methoxy, CHIENIRU methoxy, and 2-oxazolyl -- 2-thiazolyl or benzene SURUHON amide (this FENOKISHI and benzyloxy one --) [a phenyl, Ben Jill, benzene SURUHON amide, pyridyl methoxy, CHIENIRU methoxy, 2-oxazolyl, and 2-thiazolyl]. Halogen, C1-6 ARUKIRU, trifluoromethyl, and C1-6 alkoxy ** Even if it has 1 or two pieces, when combining good; or R1bb, and R2bb with an adjoining carbon atom, Xbb the substituent chosen from cyano, nitroglycerine, and HIDOROKISHI Oxygen, It becomes together with the carbon atom which these combine, when it is sulfur or NR4bb (R4bb is hydrogen or C1-4 ARUKIRU), and is a formula.

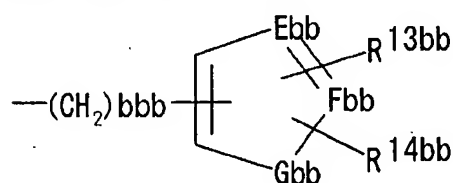
[0058]

[Chemical formula 39]



Among [type, 1 or 2, and R3bb show oxygen, sulfur, or NR4bb, abb shows oxygen, sulfur, NH, CHCH₃, C(CH₃)₂, -CH=CH-, or (CH₂) lbb, and, as for Jbb, lbb shows the integer of 1 to 3, as for hydrogen or C1-6 ARUKIRU Qbb. Formation; Xbb the basis expressed with] Oxygen, sulfur, -CH=CH-, -CH=N-, -NH=CH- and -N=N- or -- NR4bb; (R4bb is above and this meaning) Ybb -(CH₂) mbb- - CH=CH(CH₂) nbb- and -NR4bb(CH₂) mbb--O(CH₂) mbb- or -- (R4bb -- the above and this meaning --) nbb is the integer of 0 to 3 and mbb is integer; Mbb of 1 to 3. -CH - Or nitrogen; Lbb i halogen, Phenyl or phenyl C1-6 ARUKIRU which may have 1 to 3 substituents chosen from C1-6 ARUKIRU and C1-6 alkoxy **C1-6 alkoxy KARUBONIRU or C1-6 Al ****- Calvo Nils, respectively, ii) SHINNAMIRU, iii pyridyl methyl, or iv type :

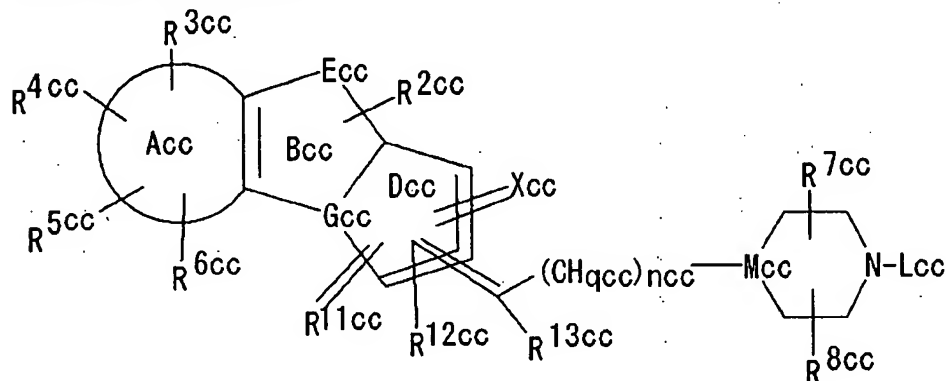
[Chemical formula 40]



As for the integer, R13bb, and R14bb of 1 to 4, in bbb, hydrogen, C1-4 ARUKIRU, halogen or a phenyl, and Ebb and Fbb show oxygen, sulfur, or NR4bb (R4bb is the above and this meaning) among [type, respectively, as for -CH- or nitrogen, and Gbb. However, when both Ebb and Fbb are nitrogen, either R13bb or R14bb does not exist. Basis; R7bb and R8bb which are expressed with] show hydrogen, C1-6 ARUKIRU, C1-6 alkoxy KARUBONIRU, C1-6 Al ****- Calvo Nils, or C1-6 ARUKOKISHI, respectively. However, it does not combine with the carbon atom which adjoins this C1-6 alkoxy *****. The compound expressed with], or its salt. As an example, 3-[2-[1-(phenylmethyl)-4-piperidiny] ethyl]-5, 6, 8-trihydro 7H-iso [4 and 5-KISAZORO g] Kino ****- 7-ON, 6 and 8-dihydro3-[2-[1-(phenylmethyl)-4-piperidiny] ethyl]-7H-[5 and 4-pyrrolo g]-1, 2-BENZU isoxazole 7-ON, 5 and 7-dihydro3-[2-[1-(phenylmethyl)-4-PIPERIRU] ethyl]-6H-[5 and 4-pyrrolo f]-1 and 2-BENZU isoxazole 6-ON etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H6-500794,A (WO 92/17475), or it.

[0059] 4) Formula

[Chemical formula 41]



Ring Acc among [type Benzo** thieno, pyrid, pyrazino, pyrimide, Flannel, Ceret Noro, or pyrrolo; R2cc Hydrogen, C1-4 ARUKIRU, Ben Jill, a fluoro or cyano; R3cc, R4cc, R5cc, and R6cc, respectively Hydrogen, C1-6 alkoxy ** benzyloxy, FENOKISHI, hydroxy ** A phenyl, Ben Jill, halogen, nitroglycerine, cyano, -COOR9cc, -CONHR9cc, -NR9ccR10cc, -NR9ccCOR10cc, Or C1-6 ARUKIRU which may be replaced by 1 to 3 fluoride atoms; SOpccCH2-phenyl (pcc is 0, 1, or 2), Pyridyl methyloxy or CHIENIRU methyloxy ([this FENOKISHI, benzyloxy one, a phenyl, pyridyl methyloxy, and CHIENIRU methyloxy]) Halogen, C1-4 ARUKIRU, trifluoromethyl, and C1-4 alkoxy ** the substituent chosen from cyano, nitroglycerine, and HIDOROKISHI -- 1 -- or you may have two pieces --; or R -- two, three cc R four cc R five cc and R6cc, become together with an adjoining carbon atom -- this

contiguity carbon atom -- each atom of a ring -- carbon -- the saturation 5 which is nitrogen or oxygen, or six membered-rings (for example, methylene dioxy --) ethylene dioxy or a RAKUTAMU ring -- formation; -- R9cc and R10cc -- respectively -- hydrogen or C -- one to 6 ARUKIRU Or it becomes together R9cc of formation or NR9ccCOR10cc, and R10cc about 4 or the 8 membered-ring-like amino group whose others R9cc of NR9ccR10cc and R10cc become together, one atom of a ring is nitrogen, and are carbon, and 4 or a 8 membered-ring-like RAKUTAMU ring is formed.;

[0060] Gcc -- carbon or nitrogen; -- Ecc -- carbon, nitrogen, oxygen, sulfur, sulfo KISHIDO, or Sour Hong;

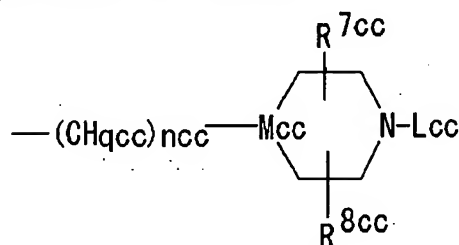
[Chemical formula 42]

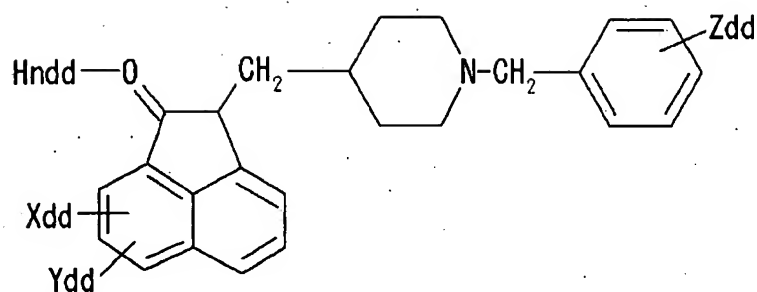
***** or a double bond; When the carbon in either like 1- of Ring Dcc, 2-, or 3-adjoints the carbonyl group, ;(since this carbon is at least in 1-, 2-, or 3- of Ring Dcc, ring turns into RAKUTAMU ring) Xcc which may be suitably replaced with nitrogen O, S, NOR1cc, hydrogen, or C1-6 ARUKIRU (however, [an atom / the atom of the ring Dcc which Xcc has combined is carbon, and]) When Xcc(s) are O, S, and NOR1cc and 1 or the 2; ring Dcc of hydrogen or C1-6 ARUKIRU; qcc is a RAKUTAMU ring as for; R1cc, as for, Xcc carries out a double bond to Ring Dcc, When the integer of 1 to 3 and Ring Dcc of ncc are not RAKUTAMU rings, as for ncc, carbon or nitrogen; Lcc integer; Mcc of 0, or 1 to 3 A phenyl, Phenyl C1-6 ARUKIRU, SHINNAMIRU, or pyridyl methyl ([this phenyl and phenyl C1-6 ARUKIRU]) Even if it has 1 to 3 substituents chosen from C1-6 ARUKIRU and C1-6 alkoxy **C1-6 alkoxy KARUBONIRU, C1-6 Al ****- Calvo Nils, and halogen, good; R11cc Hydrogen, halogen, hydroxy **C1-4 ARUKIRU, C1-4 alkoxy **** -- oxygen; -- [R12cc and R13cc], respectively Hydrogen, a fluoro, hydroxy ** acetoxy, o-MESHIRETO, o-tosylate, When both (C1-4 ARUKIRU or C1-4 alkoxy; or R12cc, and R13cc) have combined with the carbon atom, Become together with the atom which they have combined and each atom of a ring 3 or the five-membered ring which is carbon or oxygen formation; R7cc and R8cc, respectively Hydrogen, C1-6 ARUKIRU, or C1-6 alkoxy ([it this C-1---6-alkoxy-**, and]) it does not combine with the carbon which adjoins nitrogen, C1-6 alkoxy KARUBONIRU, and C1-6 Al ****- Calvo Nils --; or R8cc, and R12cc, it becomes together with the atom which they have combined, and 4 to 7 member saturation carbon ring is formed (one of the above-mentioned carbon atoms -- oxygen --) You may be

replaced by nitrogen or sulfur.

[0061] However, when (a) Ecc is carbon, nitrogen, oxygen, sulfur, sulfo KISHIDO, or Sour Hong, Gcc is carbon, and when; (b) Gcc is nitrogen, Ecc is carbon or nitrogen --; (c) -- when both Ecc and Gcc are nitrogen When Gcc is carbon and Ecc is oxygen, sulfur, sulfo KISHIDO, or Sour Hong, When there is no R2cc, each of the atom like 1- of the; (d) ring Dcc, 2-, and 3-is not combined by the double bond which surpassed one and; (e) R11cc is oxygen, Carry out a double bond to Ring Dcc, when R11cc is except oxygen, carry out single combination at Ring Dcc, and both (; (f) Xcc and R11cc) [oxygen] And it has combined with the carbon like 1- of Ring Dcc, and 3-respectively, or when having combined with the carbon like 3- of Ring Dcc, and 1-respectively, the carbon like 2-of Ring Dcc is replaced by nitrogen.; (g)

[Chemical formula 43]

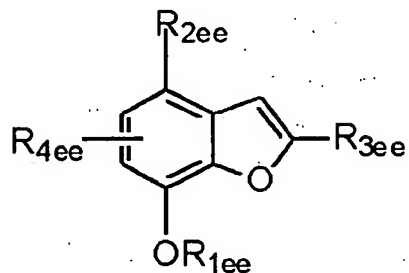




Xdd among [type Hydrogen, low-grade ARUKIRU, and low-grade alkoxy ** hydroxy **** -- nitroglycerine; -- Ydd combines hydrogen or low-grade alkoxy, or Xdd and Ydd together -- A basis - OCH₂O - formation (in this case, each position of Xdd and Ydd for benzene ring part must adjoin mutually); Zdd -- hydrogen -- [and] [low-grade] Low-grade alkoxy ** hydroxy ** halogen or nitroglycerine; ndd is 0 or 1. The compound expressed with], or its salt. As an example, 2-[(N-benzorUPIPE lysine 4-IRU) MECHIRU]-2a, 3 and 4, 5-tetrahydro 1(2H)-ASENAFU Tschirren 1-ON, 2-[[N-(3-fluoro BENJIRU) *****- 4-IRU] MECHIRU]-2a, 3 and 4, and 5-tetrahydro 1(2H)-ASENAFU Tschirren 1-ON etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H6-116237,A (EP-A-517221, USP 5,106,856), or it.

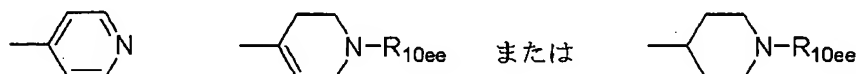
[0063] 6) Formula

[Chemical formula 45]



As for the inside of [type, and R1ee, hydrogen, low-grade ARUKIRU, and ARIRU low-grade ARUKIRU, CONHR11ee, or CONR6eeR7 ee; R2ee is hydrogen, cyano, CH₂NR8eeR9ee, CONHR5ee, or CONR6eeR7 ee; R3ee.

[Chemical formula 46]

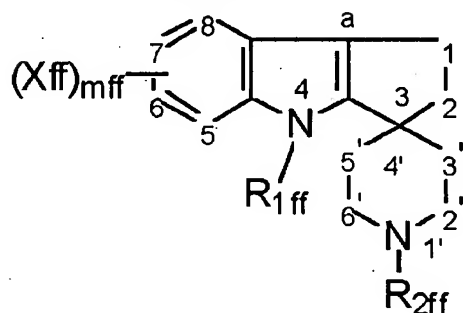


here -- R10ee -- hydrogen -- [and] [low-grade] [ARIRU low-grade] A certain; R4ee by

CONHR5ee, CONR6eeR7ee, ASHIRU, reed RUOKISHI low-grade ARUKIRU, or reed RUOKISHIA reel low-grade ARUKIRU Hydrogen, Halogen, low-grade ARUKIRU, or low-grade alkoxy; R5ee Hydrogen, low-grade ARUKIRU or ARIRU -- low-grade -- ARUKIRU; R6ee -- low-grade ARUKIRU or ARIRU -- low-grade -- ARUKIRU; R7ee -- low-grade ARUKIRU or ARIRU -- low-grade -- ARUKIRU; R8ee -- hydrogen -- Hydrogen, low-grade ARUKIRU, or ARIRU low-grade ARUKIRU; R11ee of low-grade ARUKIRU and ARIRU low-grade ARUKIRU or ASHIRU; R9ee is low-grade ARUKIRU, ARIRU, or ARIRU low-grade ARUKIRU. However, R2ee is not hydrogen when R1ee is hydrogen or low-grade ARUKIRU. The compound expressed with], or its salt. As an example, 1-*****- 4-(4-cyano 7-*****- 2-benzofuranyl) PIPERIJIN, 1-*****- 4-(4-N and N-JIECHIRU amide 7-*****- 2-benzofuranyl) PIPERIJIN, 1-*****- 4-(4-N and N-diethylamino *****- 7-*****- 2-benzofuranyl) PIPERIJIN, etc. are mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H7-109275,A, or it.

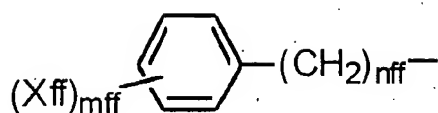
[0064] 7) Formula

[Chemical formula 47]



As for 1 or 2; R1ff, in trifluoromethyl; mff, hydrogen or low-grade ARUKIRU; R2ff is [the inside of [type, and Xff / hydrogen, halogen, low-grade alkoxy ** low-grade ARUKIRU and hydroxy ****] hydrogen and a formula.

[Chemical formula 48]



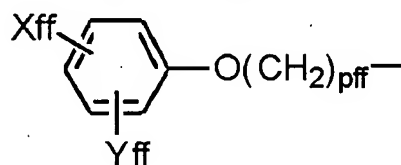
It is the basis and formula which are expressed with (nff shows the above and this meaning among a formula, as for 1 or 2, Xff, and mff).

[Chemical formula 49]



They are the basis expressed with (Xff and mff show the above and this meaning among a formula), or a formula.

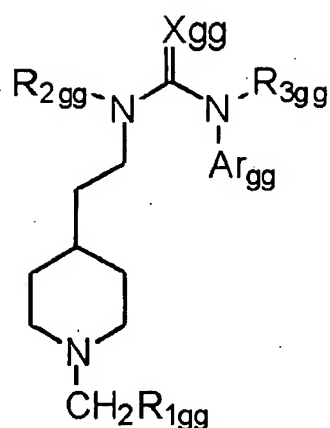
[Chemical formula 50]



It is (Xff shows the above and this meaning among a formula, Yff shows hydrogen or formula: COR4ff (R4ff shows hydrogen or low-grade ARUKIRU among a formula), and pff shows 2 or 3). The compound expressed with], or its salt. concrete -- 1 and 4-dihydro7-*****- 4-*****- 1'-phenylmethyl SUPIRO [-- cyclopent [b] Indore 3 (2H) -- four -- ' - PIPERIJIN --] -- one -- four - dihydro one -- four - ***** - -- one -- ' - (4-methoxypheny) -- MECHIRUSUPIRO -- [-- a cyclopent -- [-- b --] -- Indore -- three (2H) -- four -- ' - PIPERIJIN --] - - etc. -- mentioning -- having . The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to the method of WO 97/37992 description, or it.

[0065] 8) Formula

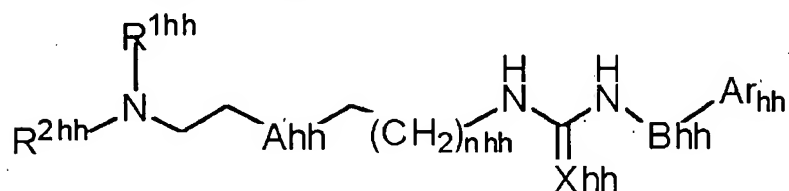
[Chemical formula 51]



R1gg among [type A C5-7 cycloalkyl machine, a phenyl group, or C1-4 alkyl group, [phenyl group; R2gg and R3gg which were replaced by the C1-4 alkoxy group, the nitro group, or the halogen atom] Hydrogen atom or C1-4 alkyl-group; Xgg independently mutually A sulfur atom, an oxygen atom, two CH-NO, or a N-R5gg basis (here -- R5gg -- a hydrogen atom --)] [hydronalium KISHIRU machine, C1-4 alkoxy group, C1-4 alkyl-group, cyano group, or C1-4 ARUKIRU sulfonyl group; Argg] A halogen atom, C1-4 alkyl group, C1-4 alkoxy group, and C1-4 acyl group, 1, the pyridyl machine which you may have two or more, respectively, or a phenyl group is meant for the substituent chosen from a cyano group, a nitro group, a trifluoromethyl machine, and a trifluoro methoxy group. The compound expressed with], or its salt. As an example, N-phenyl N'-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl]-1 and 1-Gia Minaux 2-nitroglycerine ethylene, 1-(2-pyridyl)-3-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl] thiourea, 1-phenyl 2-hydroxy 3-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl] guanidine, etc. are mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP, H5-148228, A (EP-A-516520), or it.

[0066] 9) Formula

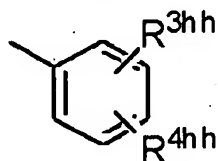
[Chemical formula 52]



C1-4 alkyl group and R2hh among [type R1hh A C5-7 cycloalkyl machine, A C5-7 cycloalkyl methyl group, a benzyl group, or C1-4 alkyl group, As for oxygen atom or methylene

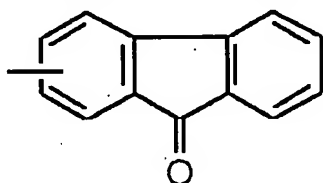
machine;Bhh, in benzyl group;Ahh which has C1-4 alkoxyl group, a halogen atom, or a nitro group, direct combination and methylene machine or carbonyl group;Arhh(s) are a pyridyl machine and the phenyl group of a bottom type,

[Chemical formula 53]



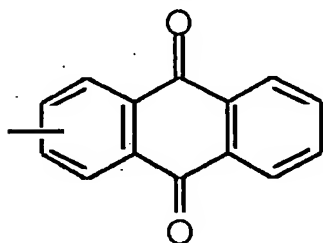
It is the OKISO fluorenyl group of the bottom type (as which here, R3hh and R4hh mean independently hydrogen, a halogen atom, a nitro group, C1-4 alkyl group, C1-4 alkoxyl group, a phenyl group, or a trifluoro methoxy group mutually),

[Chemical formula 54]



The dioxo anthracenyl group of a bottom type,

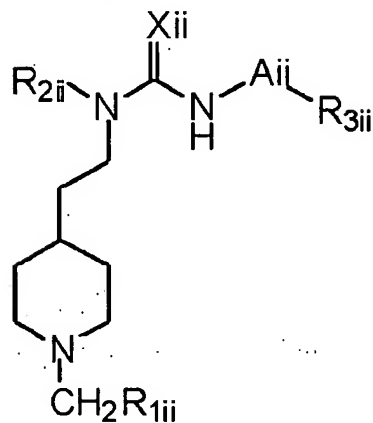
[Chemical formula 55]



Or nhh means 1 or 2 and Xhh means an oxygen atom or a sulfur atom for the Naff Chill machine. The compound expressed with], or its salt. As an example, 1-[2-[2-(N-benzoroux N-methylamino) ethoxy] ethyl]-3-(3-nitrobenzoyl) thiourea, 1-[2-[2-(N-benzoroux N-methylamino) ethoxy] ethyl]-3-(9-*****- 2-full ORENOIRU) thiourea etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H5-194359,A (EP-A-526313), or it.

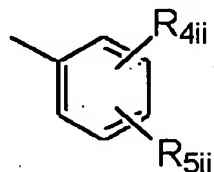
[0067] 10) Formula

[Chemical formula 56]



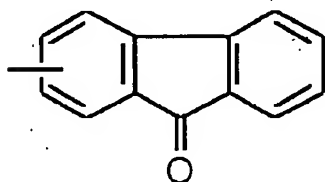
R $_{1\text{ii}}$ among [type A C5-7 cycloalkyl machine, a phenyl group, or C1-4 alkyl group, As for oxygen atom or sulfur atom; A $_{\text{ii}}$, in hydrogen atom or C1-4 alkyl-group; X $_{\text{ii}}$, methylene machine, carbonyl group, or sulfonyl group; R $_{3\text{ii}}$ is [phenyl group; R $_{2\text{ii}}$ replaced by the C1-4 alkoxyl group or the halogen atom] (1) type.

[Chemical formula 57]



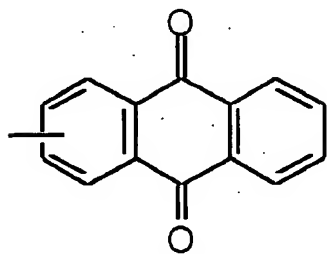
R $_{4\text{ii}}$ and R $_{5\text{ii}}$ become independent mutually here -- hydrogen and a halogen atom -- A nitro group, C1-4 alkyl group, C1-4 alkoxyl group, and C1-4 acyl group, The basis, (2) type which express a benzoyl group, a C1-4 ARUKIRU sulfonyl group, or a trifluoro methoxy group, or R $_{4\text{ii}}$ and R $_{5\text{ii}}$ become together and are expressed with formation in a methylene dioxy machine

[Chemical formula 58]



The basis or (3) type come out of and expressed

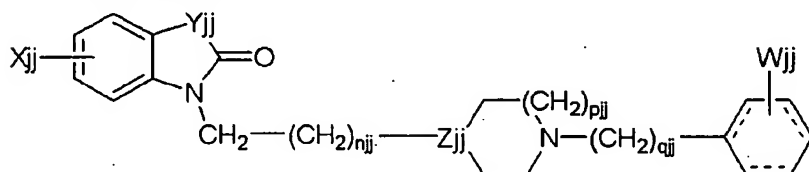
[Chemical formula 59]



When it comes out and basis; expressed, however Xii express an oxygen atom, Aii expresses the basis besides methylene Motomochi. The compound expressed with], or its salt. As an example, 1-(3-nitrobenzoyl)-3-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl] thiourea, 1-(9, 10-dioxo 2-anthra SENOIRU)-3-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl] thiourea, etc. are mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H6-507387,A (WO 92/14710), or it.

[0068] 11) Formula

[Chemical formula 60]



Among [type, njj is 1, 2, or 3,;pjj is 1 or 2,;qjj is 1 or 2, and;Xjj becomes independent, and Hydrogen, Low-grade ARUKIRU, ARIRU, aryloxy, CN, low-grade alkoxy ** halogen, hydroxy ** nitroglycerine, trifluoromethyl, ARUKIRUSURU phone amide, NHCORjj (here) Rjj is a certain NR1jjR2jj (here) at low-grade ARUKIRU or ARIRU. It is CO2Rjj (here) which becomes [whether R1jj and R2jj are hydrogen or low-grade ARUKIRU independently and], and forms a ring. [Rjj] depending on the case or Rjj is low-grade ARUKIRU Furthermore, it is one or more substituents chosen from cycloalkyl, cyclo ARUKENIRU, or bicyclo ARUKIRU replaced by low-grade ARUKIRU, and;Yjj is CO or CR3jjR4jj (here). R3jj and R4jj become independent -- hydrogen, low-grade ARUKIRU, and low-grade alkoxy ***** -- or it becomes together and cyclic acetal is formed -- it is --;Zjj is N or CH --;

[Chemical formula 61]



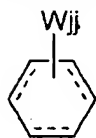
It is the phenyl or cyclohexyl machine replaced depending on the ** case (here). W_{jj}(s) are one or more substituents as which hydrogen, low-grade ARUKIRU, and low-grade alkoxy **** is chosen from halogen independently -- the compound (however, n_{jj}=1, p_{jj}=1, q_{jj}=1, X_{jj}=H, Y_{jj}=CO, and Z_{jj}=N -- and) expressed with]

[Chemical formula 62]



the compound which is a **** substitution phenyl and njj=2, pj=1, qj=1, Xj=H, Yj=CO, and Zj=N -- and

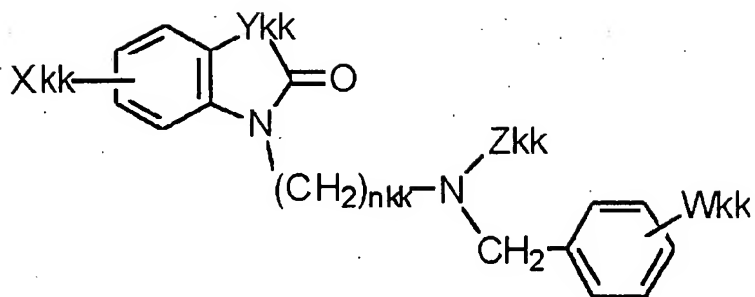
[Chemical formula 63]



The stereoisomerism object excluding the compound which is ** 4-chlorophenyl, an optical isomer, racemate, or those salt. As an example, 5-Shiloh *****- 1 and 3-dihydro1-[2-[1-(phenylmethyl)-4-piperidinyl] ethyl]-2H-Indore 2-ON etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H7-502272.A (WO 93/12085), or it.

[0069] 12) Formula

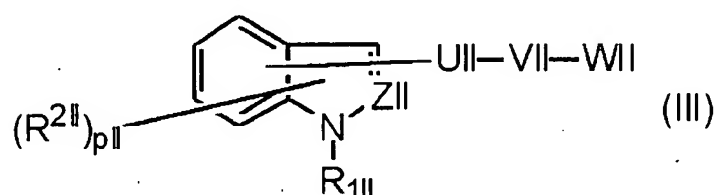
[Chemical formula 64]



The inside of [type and nkk become independent and 3, 4, 5, 6, or 7; Xkk is hydrogen, low-grade ARUKIRU, ARIRU, low-grade alkoxy **, halogen, trifluoromethyl, nitroglycerine, and -NHCORkk (here). Rkk is a certain -NR1kkR2kk (here) at low-grade ARUKIRU or ARIRU. [kk / R1kk and R2kk are hydrogen or low-grade ARUKIRU independently, or become together, and form a ring, or.] depending on the case Furthermore, one or more substituent; Ykk(s) chosen from cycloalkyl, cyclo ARUKENIRU, or bicyclo ARUKIRU replaced by low-grade ARUKIRU are CO or CR3kkR4kk (here). R3kk and R4kk become independent -- hydrogen, low-grade ARUKIRU, and low-grade alkoxy ***** or; Zkk which becomes together and forms cyclic acetal -- low-grade ARUKIRU; -- and Wkk(s) are one or more substituents as which hydrogen, low-grade ARUKIRU, and low-grade alkoxy **** is chosen from halogen independently. The compound expressed with], its stereoisomerism object, an optical isomer, racemate, or those salt. As an example, 5-cyclohexyl 1 and 3-dihydro1-[5-(N-ethyl N-phenyl methylamino) Penn Chill]-2H-Indore 2-ON, 5-cyclohexyl 1-[5-(N-ethyl N-phenyl methylamino) Penn Chill]-1H-Indore 2, 3-dione, etc. are mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP, H8-511515, A (WO 94/29272), or it.

[0070] 13) Formula

[Chemical formula 65]

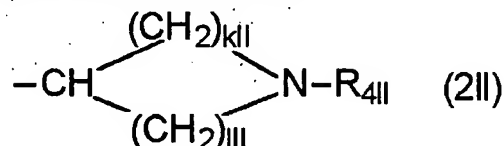


The basis as which R1II and R2II were chosen from the hydrogen atom and the following substituent group All among [type, respectively, Or the aryl group which may have 1 to 3 substituents (being the same or different) chosen from the following substituent group All, respectively, ARARUKIRU machine, aralkyloxy carbonyl group, arylamino machine, arylamino

alkyl-group, heterocyclic machine, heterocyclic alkyl-group, or heterocyclic amino alkyl-group; pII shows the integer of 1 to 3. ; UII -- formula: -- basis expressed with -CO- or -- -CH (OR3II)- (among a formula) R3II shows the blocking group of a hydrogen atom or a hydroxyl group -- the basis (as for mII, 0 to 2, and nII show the integer of 0 to 7 among a formula.) to which; VII is expressed with formula: -(CH=CH) mII-(CH2) nII- However, it is the nitrogen-containing heterocyclic machine with which it twists that mII and nII are 0 simultaneously, and; VII has VII and a together joining point on the nitrogen atom in a ring.

[0071] Formula

[Chemical formula 66]

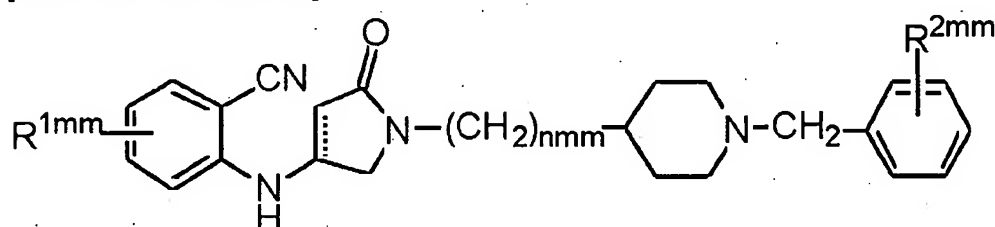


The basis come out of and expressed (among a formula, kII and lII are the same or different, and 1 to 4, and R4II have R5II and after-mentioned R6II, and this after-mentioned meaning); In the above-mentioned general formula (2II) the time of a ring alkylene machine forming 5 or 6 membered-rings -- this -- the basis which 5, the ethylene group in 6 membered-rings and 1, or two benzene rings condense -- Or a formula: The basis expressed with -NR5IIR6II ([R5II and R6II] among a formula, respectively) A hydrogen atom, the basis chosen from the following substituent group All, or the aryl group which may have 1 to 3 substituents (being the same or different) chosen from the following substituent group All, respectively, An ARIRU carbonyl group, an ARARUKIRU machine, a heterocyclic machine, or a heterocyclic alkyl group is shown. It is shown. Substituent group All : A low-grade alkyl group, a cycloalkyl machine, an aryl group, A heterocyclic machine, an ARARUKIRU machine, a halogen atom, an amino group, a low-grade alkylamino machine, An arylamino machine, an amino low-grade alkyl group, a low-grade alkylamino alkyl group, A low-grade alkynyl amino alkyl group, a nitro group, a cyano group, the Sour Fo Nils machine, A low-grade ARUKIRUSURUFONIRU machine, a halogeno ARUKIRUSURUFONIRU machine, a low-grade alkanoyl machine, An ARIRU carbonyl group, an ARIRU alkanoyl machine, a lower alkoxy group, a low-grade alkoxy carbonyl group, a halogeno low-grade alkyl group, N-low-grade alkynyl, N-cyano amino group, N-low-grade alkynyl, and N-methylamino methyl group. The compound expressed with], or its salt. As an example, 1-*****- 3-[3-(1-benzoroux 4-piperidyl) pro PIONIRU] Indore, 1-*****- 3-

[3-[1-(3-fluoro BENJIRU)-4-piperidyl] pro PIONIRU]-5-fluoro Indore and 1-*****- 3-[3-[1-(2-chloro BENJIRU)-4-piperidyl] pro PIONIRU] indazole etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in the JP,H6-41070,A number gazette (EP-A-562832), or it.

[0072] 14) Formula

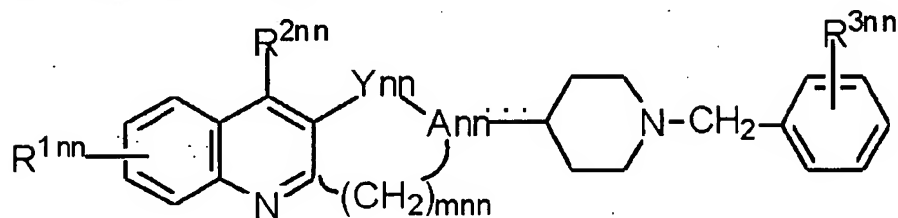
[Chemical formula 67]



Hydrogen atom, halogen atom, alkyl-group, or alkoxy group;nmm shows among [type that, as for the integer; dashed line of 0-7, a double bond may exist R1mm a hydrogen atom, a halogen atom, an alkyl group, an alkoxy group, or ARUKIRUCHIO machine;R2mm. The compound expressed with], or its salt. As an example, N-[1-[4-(1-BENJIRU piperidyl) ethyl]-2-*****- 3-pyrroline 4-IRU]-2-amino benzonitril, N-[1-[4-(1-BENJIRU piperidyl) pro pill]-2-*****- 3-pyrroline 4-IRU]-2-amino benzonitril etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H5-9188,A, or it.

[0073] 15) Formula

[Chemical formula 68]



Inside of [type,

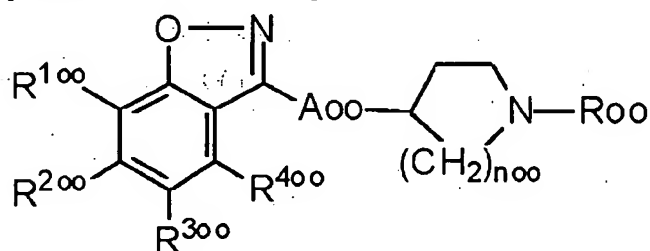
[Chemical formula 69]



** and $>\text{N}-(\text{CH}_2) \text{nnn-}$, $>\text{C=}$, and $>\text{C}=\text{CH}(\text{CH}_2) \text{nnn-}$ or $-->\text{CH}(\text{CH}_2) \text{nnn-}$ (nnn shows integer of 0-7 here); $\text{Ynn } >\text{C}=\text{O}$ or $-->\text{CHOH}$; R1nn -- a hydrogen atom, a halogen atom, and an alkyl group -- An alkoxy group or an ARUKIRUCHIO machine; R2nn A hydrogen atom, a halogen atom, As for hydrogen atom, halogen atom, alkyl-group, or alkoxy group; mn , amino group; R3nn which may have the phenyl group, the phenoxy group, alkanoloxo machine, or substituent which may have a hydroxyl group, an alkyl group, an alkoxy group, and a substituent shows the integer of 1-3. The compound expressed with], or its salt. As an example, 9-amino 2-[4-(1-BENJIRU piperidyl) ethyl]-2, 3-dihydro[3 and 4-pyrrolo b] Kino ****-1-ON, 9-amino 2-[2-(1-benzoRUIPE lysine 4-IRU) ethyl]-1, 2 and 3, 4-tetrahydro bitter taste lysine 1-ON, 9-*****- 2-[4-(1-BENJIRU piperidyl) ethyl]-2, and 3-dihydro[3 and 4-pyrrolo b] Kino ****- 1-ON etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H5-279355,A (EP-A-481429), or it.

[0074] 16) Formula

[Chemical formula 70]

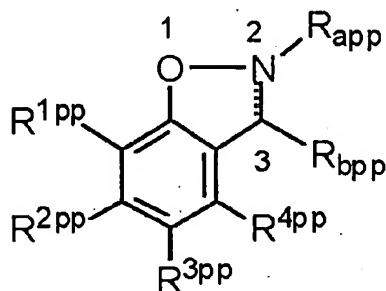


Roo among [type Hydrogen, ARUKIRU, ARUKENIRU, cycloalkyl ARUKIRU, Phenyl ARUKIRU, NAFUCHIRUARUKIRU, cycloalkyl ARUKENIRU, Phenyl ARUKENIRU or NAFUCHIRUARUKENIRU; R1oo , R2oo , R3oo and R4oo are the same or different, and, respectively Hydrogen, halogen, ARUKIRU, a phenyl, phenyl ARUKIRU, alkoxy ** heteroaryl, Heteroarylalkyl, phenylalkoxy, FENOKISHI, and heteroaryl alkoxy ** Heteroaryloxy, ASHIRU, reed RUOKISHI, a hydroxyl group, nitroglycerine, cyano, - NHCOR5oo , - S(O) mooR5oo , - NHSO2R5oo , - CONR6ooR7oo , - NR6ooR7oo , - OCONR6ooR7oo , - OCSNR6ooR7oo and - SO2NR6ooR7oo or -- [what / what - COOR8oo ; or R1oo , R2oo , R3oo , and R4oo adjoin joins mutually together, and] - $\text{O}(\text{CH}_2) \text{poo-}$ which may have a substituent, - $\text{O}(\text{CH}_2) \text{qooO-}$, - $\text{O}(\text{CH}_2) \text{rooN(R9oo)-}$, - $\text{O}(\text{CH}_2) \text{sooCON(R9oo)-}$, - The basis which forms N(R9oo) CO-CH=CH- , a benzene ring, or a complex aromatic ring is shown (here, [R5oo]). ARUKIRU, a phenyl or

phenyl ARUKIRU; R600, and R700 are the same or different. [basis; R800 which combines the nitrogen atom which shows hydrogen, ARUKIRU, a phenyl, or phenyl ARUKIRU, respectively, or adjoins and forms heterocycle] [ARUKIRU, a phenyl, or phenyl ARUKIRU; R900] Hydrogen, ARUKIRU, phenyl ARUKIRU, or ASHIRU; [moo] 0, 1 or 2; poo, qoo, roo, and soo are the same or different. Alkylene; noo of a straight chain or the shape of a branching chain; Aoo which shows 1, 2, or 3 Under the 1, 2, or 3; above-mentioned definition, ARUKIRU, ARUKENIRU, an alkoxy ** phenyl, FENOKISHI, cycloalkyl ARUKIRU, Phenyl ARUKIRU, NAFUCHIRUARUKIRU, cycloalkyl ARUKENIRU, Phenyl ARUKENIRU, NAFUCHIRUARUKENIRU, phenylalkoxy, heteroaryl, Heteroaryloxy, heteroarylalkyl, a heteroaryl alkoxy ** benzene ring, and a complex aromatic ring Halogen, ARUKIRU, alkoxy ** ASHIRU, reed RUOKISHI, a hydroxyl group, nitroglycerine, cyano -NHCOR500, -S(O) mooR500, -NH₂SO₂R500, -CONR600R700, -NR600R700, -OCONR600R700, -OCSNR600R700, and -SO₂NR600R700-COOR800 or -- (here) R500, R600, R700, and R800 It reaches. moo may have 1 to 3 substituents chosen from it being synonymous with the above. The compound expressed with], or its salt. As an example, 3-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl]-6, 7-dimethoxy 1, 2-benzolSOOKI Southall, 3-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl]-6-(N-MECHIRU acetamino)-1 and 2-benzolSOOKI Southall etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP, H5-320160, A (WO 93/04063), or it.

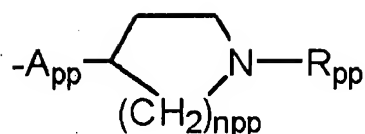
[0075] 17) Formula

[Chemical formula 71]



R_{app} is a formula when combination between the 2nd place and the 3rd place of [type shows a single bond.

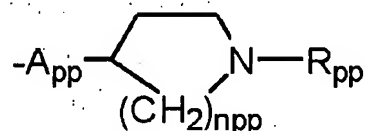
[Chemical formula 72]



the inside of a formula, and Rpp -- hydrogen -- [and] [ARUKIRU, ARUKENIRU and] [cycloalkyl] cycloalkyl ARUKENIRU, phenyl ARUKIRU, phenyl ARUKENIRU, NAFUCHIRUARUKIRU, or NAFUCHIRUARUKENIRU; App -- alkylene; npp of a straight chain or the shape of a branching chain -- 1, 2, or 3 -- being shown -- the basis expressed is shown and Rbpp shows oxygen.

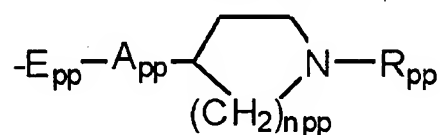
[0076] When combination between the 2nd place and the 3rd place shows a double bond, Rapp does not exist, but Rbpp is a formula.

[Chemical formula 73]



It is the basis or formula expressed by (each sign in a formula is the above and this meaning).

[Chemical formula 74]

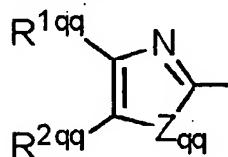


Basis; R1pp expressed by (the inside of a formula and Epp show oxygen and sulfur, and each of other sign is the above and this meaning), R2pp, R3pp, and R4pp are the same or different, and, respectively Hydrogen, Halogen, ARUKIRU, an alkoxy ** phenyl; phenyl ARUKIRU, phenylalkoxy, FENOKISHI, heteroaryl, heteroarylalkyl, and heteroaryl alkoxy ** Heteroaryloxy, ASHIRU, reed RUOKISHI, a hydroxyl group, nitroglycerine, cyano, -NHCOR5pp, -S(O)mppR5pp, -NHSO2R5pp, -CONR6ppR7pp, -NR6ppR7pp, -OCSNR6ppR7pp, and -SO2NR6ppR7pp or -- -COOR8pp is shown. ([R5pp / ARUKIRU, a phenyl or phenyl ARUKIRU; R6pp, and R7pp / be / pp / the same or different and]) [basis; R8pp which combines with the nitrogen atom which shows hydrogen, ARUKIRU, a phenyl, or phenyl

ARUKIRU, respectively or adjoins and forms heterocycle] Hydrogen, ARUKIRU, a phenyl, or phenyl ARUKIRU; [mpp] Under the; above-mentioned definition which shows 0, 1, or 2, ARUKIRU, ARUKENIRU, alkoxy ** A phenyl, phenyl ARUKIRU, phenyl ARUKENIRU, phenylalkoxy, FENOKISHI, cycloalkyl ARUKIRU, cycloalkyl ARUKENIRU, [NAFUCHIRUARUKIRU, NAFUCHIRUARUKENIRU, heteroaryl, heteroarylalkyl, and heteroaryl alkoxy ***** heteroaryloxy] Halogen, ARUKIRU, alkoxy ** ASHIRU, reed RUOKISHI, a hydroxyl group, Nitroglycerine, cyano, -NHCOR5pp, -S(O) mppR5pp, -NHSO2R5pp, -CONR6ppR7pp, -NR6ppR7pp, -OCONR6ppR7pp, -OCSNR6ppR7pp, and -SO2NR6ppR7pp-COOR8pp or -- (R5pp, R6pp, and R -- 7 pp) R8pp and mpp may have 1 to 3 substituents chosen out of being the above and this meaning. The compound expressed with], or its salt. As an example, 3-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl]-6, 7-dimethoxy 1, 2-benzolSOOKI Southall, 6-benzoylamino 2-[3-(1-benzoroux 4-piperidyl) pro pill]-1, 2-benzolSOOKI Southall 3(2H)-ON, 6-benzoylamino 2-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl]-1 and 2-benzolSOOKI Southall 3(2H)-ON etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H6-41125,A (WO 93/04063), or it.

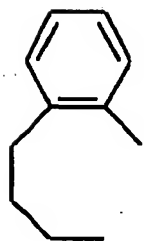
[0077] 18) Formula Mqq-Wqq-Yqq-Aqq-Qqq[The inside of a formula and Mqq are formulas. :

[Chemical formula 75]



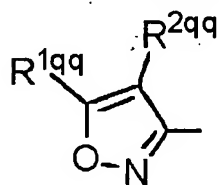
([ARIRU;R2qq which may have the heterocyclic machine or substituent in which R1qq may have hydrogen, low-grade ARUKIRU, and a substituent among the formula]) ARIRU which may have the heterocyclic machine or substituent which may have hydrogen, low-grade ARUKIRU, and a substituent is expressed, or R1qq and R2qq combine with each other, and it is a formula. :

[Chemical formula 76]



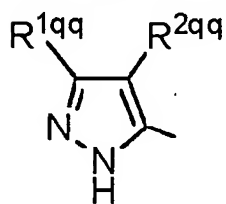
the basis come out of and expressed -- formation; Zqq -- S or O -- respectively -- being shown -
- the basis expressed and formula:

[Chemical formula 77]



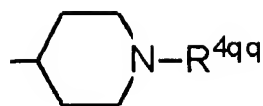
They are the basis expressed with (R1qq and R2qq show the above and this meaning among
a formula), or a formula. :

[Chemical formula 78]



[basis; Wqq expressed with (R1qq and R2qq show the above and this meaning among a
formula)] [combination, low-grade alkylene, or low-grade alkenylene; Yqq] Low-grade
alkylene and -NH-, -CO-, -CONR3qq - (among a formula) [basis; Aqq of basis / R3qq indicates
hydrogen or low-grade ARUKIRU to be /, or formula: -CHR7qq- (R7qq shows among a formula
HIDOROKISHI from which hydroxy **** was protected)] Combination or a low-grade alkylene;
Qqq is the basis or formula of formula: -NR8qqR9qq (as for R8qq, low-grade ARUKIRU; R9qq
shows Al (low-grade) ARUKIRU among a formula). :

[Chemical formula 79]

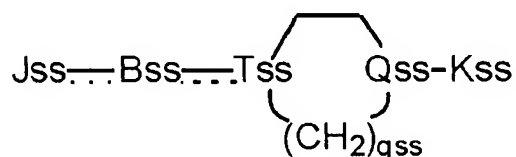


The basis expressed with (R4qq shows among a formula Al (low-grade) ARUKIRU which may have low-grade ARUKIRU or a substituent) is shown, respectively. The compound expressed with], or its salt. As an example, 4-(Pirie ****- 3-IRU)-5-*****- 2-[[2-(1-benzoRUIPE lysine 4-IRU) ethyl] Culver Moyle] thia ZORU, 2-[[2-(1-benzoRUIPE lysine 4-IRU) ethyl] Culver Moyle]-4-(4-chlorophenyl)-5-MECHIRUOKI Southall, 5-[[2-(1-benzoRUIPE lysine 4-IRU) ethyl] Culver Moyle]-3-(4-nitrophenyl) PIRAZORU, etc. are mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H5-345772,A, or it.

[0078] 19) Formula R1rr-Qrr-Zrr-Xrr-Arr-Mrr[Inside of a formula, ARIRU which may have the heterocyclic machine with which R1rr may have low-grade ARUKIRU and a substituent, and a substituent, Al (low-grade) ARUKIRU or Al (low-grade) ARUKENIRU which may have a substituent; As for Qrr, combination or vinyl;Xrr combines oxadiazole diyl;Zrr. Formula : - CONR4rr- (R4rr shows hydrogen or low-grade ARUKIRU among a formula), Formula : - CHR8rr- (R8rr shows among a formula HIDOROKISHI from which hydroxy **** was protected), - CO- or -- [-NHCO-;Arr / combination, low-grade alkylene, or low-grade alkenylene;Mrr] The heterocyclic machine containing at least one nitrogen atom which may have one substituent chosen from the group which consists of Al (low-grade) ARUKIRU which may have a low-grade ARUKIRU and IMINO blocking group and a substituent is shown, respectively. The compound expressed with], or its salt. As an example, 5-(quinuclidine 3-IRU)-3-[[2-(1-benzoRUIPE lysine 4-IRU) ethyl] Culver Moyle]-1, 2, 4-oxadiazole, 3-[[2-(1-benzoRUIPE lysine 4-IRU) ethyl] Culver Moyle]-5-(4-nitrophenyl)-1, 2, and 4-oxadiazole etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H7-502529,A (WO 93/13083), or it.

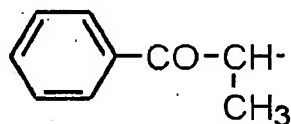
[0079] 20) Formula

[Chemical formula 80]



[; [basis / which shows Jss among a formula to the next which is not replaced / (a) substitution or] (1) phenyl group, (2) A pyridyl machine, (3) pyrazyl machine, (4) quinolyl machine, (5) cyclohexyl machine, (6) The basis; (1) indanyl of 1 value or 2 values chosen from the following group by which the quinoxalyl machine or (7) frill machine, and the (b) phenyl group may be replaced, (2) In DANONIRU, (3) indenyl, (4) indeno nil, (5) Indang Gio Nils, (6) Thet Lalo Nils, (7) BENZUSUBERONIRU, (8) INDA noryl, (9) types

[Chemical formula 81]



It comes out and the basis shown, the basis of the 1 value guided from (c) cyclic amide compound, (d) low-grade alkyl group, or the basis shown by (e) type R1 ss-CH=CH- (R1ss means a hydrogen atom or a low-grade alkoxy carbonyl group among a formula) is meant. Bss is a formula. -(CHR2ss) nss - The basis, formula which are shown -CO-(CHR2ss) nss - The basis shown, formula -NR3ss-(CHR2ss) nss- (the inside of a formula, and R3ss -- a hydrogen atom --) a low-grade alkyl group, an acyl group, a low-grade ARUKIRU sulfonyl group, the phenyl group that may be replaced, or a benzyl group -- meaning -- the basis shown -- formula -CO-NR4ss-(CHR2ss) nss- (the inside of a formula, and R4ss -- a hydrogen atom --) a low-grade alkyl group or a phenyl group -- meaning -- basis and formula-CH=CH-(CHR2ss) nss- shown the basis shown -- Formula -O-COO-(CHR2ss) nss - The basis, formula which are shown -O-CO-NH-(CHR2ss) nss - The basis shown, Formula -NH-CO-(CHR2ss) nss - The basis, formula which are shown -CH2-CO-NH-(CHR2ss) nss - The basis shown, Basis shown by formula -(CH2) 2-CO-NH-(CHR2ss) nss - (nss means the integer of 0, or 1-10 among the above formula.) The basis, formula which are shown -C(OH) H-(CHR2ss) nss - R2ss is a formula. -(CHR2ss) nss - [have / the alkylene machine shown / a substituent] Or mean a hydrogen atom or a methyl group in a form which has one or one or more methyl groups. Formula The basis shown by =(CH-CH=CH) bss- (bss means the integer of 1-3 among a formula), Formula = The basis shown by CH-(CH2) css- (css means the integer of 0, or 1-9 among a formula), Formula The basis shown by =(CH-CH) dss= (dss means the integer of 0, or 1-5 among a formula), Formula -CO-CH=CH-CH2 - The basis, formula which are shown -CO-CH2-C (OH) H-CH2 - The basis shown, Formula -C(CH3) H-CO-NH-CH2 - The basis, formula which are shown -CH=CH-CO-NH-(CH2) 2 - The basis shown, Formula -NH - The basis, formula which are shown -O - The basis, formula which are shown -S - The basis, dialkylamino ARUKIRU carbonyl group, or low-grade alkoxy carbonyl group shown is meant.

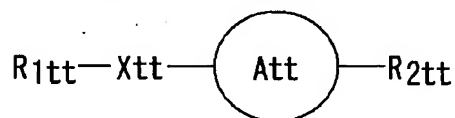
[0080] Tss means a nitrogen atom or a carbon atom. Qss means the basis shown by nitrogen atom, carbon atom, or formula $>N->O$. The ARIRU alkyl group by which, as for Kss, the phenyl group which is not replaced [a hydrogen atom, substitution, or] and a phenyl group may be replaced, A SHINNAMIRU machine [with which the phenyl group may be replaced], low-grade alkyl-group, and pyridyl methyl machine, a cycloalkyl alkyl group, an ADAMAN tongue methyl group, a frill methyl group, a cycloalkyl machine, a low-grade alkoxy carbonyl group, or an acyl group is meant. qss means the integer of 1-3. Inside of a formula,

[Chemical formula 82]

***** or a double bond is meant. The compound expressed with], or its salt. As an example, 1-benzoroux 4-[(5, 6-dimethoxy 1-Inn Danone) -2-IRU] MECHIRUPIPE lysine, N-[4'-(1'-BENJIRU piperidyl) ethyl]-2-KINOKI Sarin carboxylic amide, 4-[4'-(N-Ben Jill) piperidyl]-p-METOKISHIBUCHIROFENON, 1-[4'-(1'-benzoRUIPIPE lysine) ethyl]-1, 2 and 3, and 4-tetrahydro 5H-1-vent azepine 2-ON etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,S64-79151,A (USP 4,895,841), or it.

[0081] 21) Formula

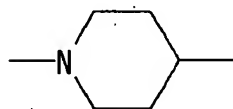
[Chemical formula 83]



The benzene with which R_{1tt} may have a substituent among [type, PIRIJIN, PIRAJIN, Indore, anthraquinone, Kino Lynne, FUTARUIMIDO that may have a substituent, HOMOFUTARUIMIDO, pyridinecarboxylic acid IMIDO, Pirie ****- N-oxide, PIRAJIN dicarboxylic acid IMIDO, NAFTA range carboxylic acid IMIDO, the KINAZO lysine dione that may have a substituent, Basis;Xtt of the 1 value guided from what is chosen from 1, 8-NAFTA RUIMIDO, bicyclo [2.2.2] oct 5-****- 2, 3-dicarboxylic acid IMIDO, and PIROMEIRUIMIDO is formula -(CH₂) mtt. - (among a formula) mtt -- the integer of 0-7 -- being shown -- the basis

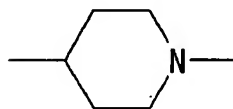
shown and formula $-O(CH_2)_n$ - The basis shown -- Formula $-S(CH_2)_n$ - The basis, formula which are shown $-NH(CH_2)_n$ - The basis shown, Formula $-SO_2NH(CH_2)_n$ - The basis, formula which are shown $-NHCO(CH_2)_n$ - The basis, formula which are shown $-NH(CH_2)_n$ - CO - The basis, formula $-COO(CH_2)_n$ which are shown - The basis, formula which are shown $-CH_2NH(CH_2)_n$ - The basis shown, Formula (during the definition of X_{tt}) $-CONR_3(CH_2)_n$ - Basis shown As for each n_{tt} , the integer of 1-7 and R_3 mean low-grade ARUKIRU or a benzyl group by an old formula. Formula $-O-CH_2CH_2CH(CH_3)-$ The basis, formula which are shown $-O-CH(CH_3)CH_2CH_2-$ The basis, formula which are shown $-O-CH_2CH_2CH=$ The basis, formula which are shown $-O-CH_2CH(OH)CH_2-$ The basis shown; Ring Att is a formula.

[Chemical formula 84]



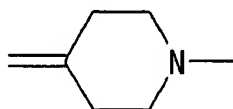
The basis, formula which are come out of and shown

[Chemical formula 85]



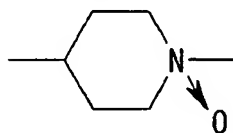
The basis, formula which are come out of and shown

[Chemical formula 86]



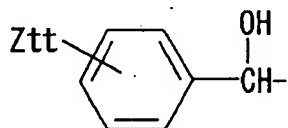
The basis come out of and shown, or a formula

[Chemical formula 87]



Basis; R_{2tt} come out of and shown is the benzyl group which may have a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, and a substituent, the benzoyl group which may have a substituent, a pyridyl machine, 2-high DOROKISHI ethyl group, a pyridyl methyl machine, or a formula.

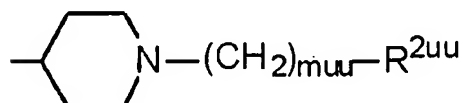
[Chemical formula 88]



The basis expressed with (Ztt means a halogen atom among a formula) is shown. The compound expressed with], or its salt. As an example, N-*****- N-[2-(1' - benzoRUIPE lysine 4'-IRU) ethyl]-4-benzoRUSURUHONIRU vent amide, N-[2-(N' - benzoRUIPE lysine 4'-IRU) ethyl]-4-NITOROFUTARUIMIDO, N-[2-(N' - benzoRUIPE lysine 4'-IRU) ethyl]-1, and 8-NAFTA RUIMIDO etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,S62-234065,A (EP-A-229391), or it.

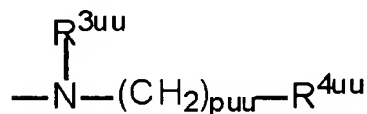
[0082] 22) Formula R_{1uu}-(CH₂)_{nuu}-Z_{uu}[As for basis; nuu guided from the cyclic amide compound with which R_{1uu} may have a substituent among the formula, integer; Z_{uu} of 0, or 1-10 is (1) type.

[Chemical formula 89]



They are the basis shown in (the aryl group and cycloalkyl machine with which R_{2uu} may have a substituent, or heterocyclic machine; muu means the integer of 1-6 among a formula), or (2) type.

[Chemical formula 90]

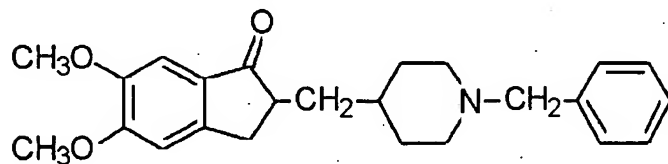


The basis shown in (the aryl group and cycloalkyl machine with which, as for R_{3uu}, hydrogen

atom or low-grade alkyl-group; R4uu may have a substituent, or heterocyclic machine; puu means the integer of 1-6 among a formula) is meant. However, in the definition of Zuu, when the cyclic amide compound which may have a substituent in the definition of R1uu is KINAZO lysine-on or KINAZO lysine dione, when R2uu and R4uu are aryl groups, it removes. The compound expressed with], or its salt. As an example, 3-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl]-5-*****- 2H-3, 4-dihydro1, 3-vent *****- 2-ON, 3-[2-[1-(4-pyridyl methyl)-4-piperidyl] ethyl]-2H-3, 4-dihydro1, 3-vent *****- 2-ON, 3-[2-[1-(1, 3-dioxo ****- 2-ylmethyl)-4-piperidyl] ethyl]-5-*****- 1, 2, and 3, 4-tetrahydro quinazoline 2, 4-dione, 3-[2-(1-benzoroux 4-piperidyl) ethyl]-6-*****- 2H-3, 4-dihydro1, 3-vent *****- 2, 4-dione, etc. are mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H4-235161,A (EP-A-468187), or it.

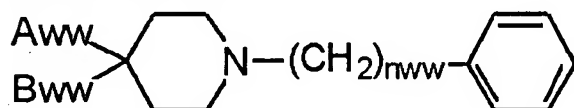
[0083] 23) Formula

[Chemical formula 91]



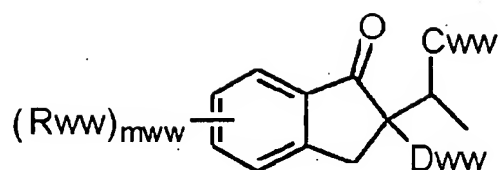
The optical activity Inn Danone derivative come out of and expressed, or its salt. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H4-21670,A, or it. 24) Formula

[Chemical formula 92]



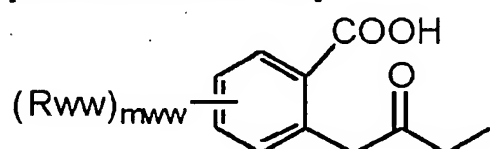
Integer; Aww of 0, or 1-2 is among [type, and nww is a formula.

[Chemical formula 93]



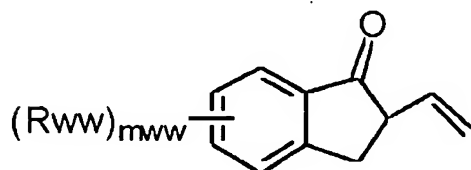
They are the basis expressed with (basis;mww which is the same or different and is chosen from a hydrogen atom, a low-grade alkyl group, and a lower alkoxy group means [as for Cww] the integer of 0, or 1-4 among a formula in hydrogen atom or low-grade hydroxyalkyl machine;Rww, as for hydrogen atom or hydroxy group;Dww), or a formula.

[Chemical formula 94]



(-- among a formula, basis;Bww which is expressed with the above and this meaning) as for each sign shows a hydrogen atom or a hydroxy group, and;Aww and Bww form a double bond -- a formula

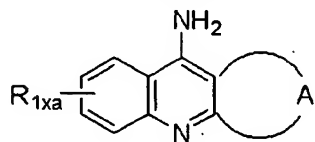
[Chemical formula 95]



(-- each sign may form among a formula the basis expressed with the above and this meaning). The compound expressed with], or its salt. As an example, 1-benzoroux 4-(5, 6-dimethoxy 1-Inn Danone 2-IRU) hydroxymethyl PIPERIJIN, 1-benzoroux 4-(5, 6-dimethoxy 2-hydroxymethyl 1-Inn Danone 2-IRU) MECHIRUPIPE lysine, 1-benzoroux 4-[3-(4, 5-dimethoxy 2-carboxyphenyl)-2-OKISO] pro PIRUPIPE lysine, etc. are mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H9-268176,A, or it.

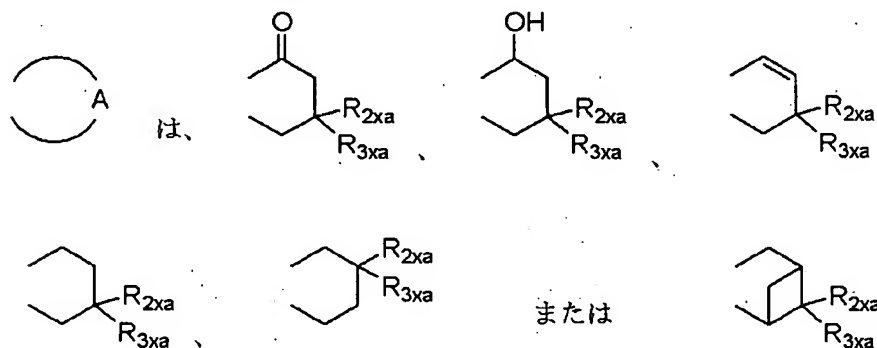
[0084] 25) Formula

[Chemical formula 96]



The inside of [type and R1xa are hydrogen, halogen, a hydroxy group, a lower alkoxy group, a low-grade alkyl group, or a mono-(or II or bird) HARO (low-grade) alkyl group,

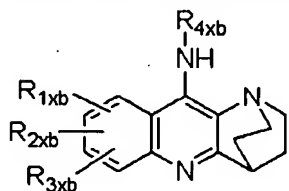
[Chemical formula 97]



(-- R2xa and R3xa mean a low-grade alkyl group among a formula, respectively.) -- it means. The compound expressed with], or its salt. As an example, 9-amino 6-chloro 3, 3-***** 1, 2, and 3, 4-tetrahydro AKURIJIN, etc. are mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H2-167267,A, or it.

[0085] 26) Formula

[Chemical formula 98]

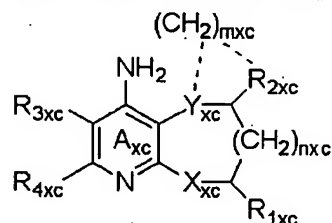


R1xb, R2xb, and R3xb among [type, respectively A hydrogen atom, a halogen atom, A trifluoromethyl machine, low-grade alkyl-group, and low-grade cycloalkyl machine, a lower alkoxy group, A low-grade alkoxy methyl group, a low-grade ARUKIRUCHIO machine, a nitro group, an amino group, A low-grade alkanoyl amino machine, a low-grade alkylamino machine, a hydronalium KISHIRU machine, The phenyl group replaced by the phenyl group or the halogen atom, the low-grade alkyl group, or the lower alkoxy group is expressed. R4xb A

hydrogen atom, low-grade alkyl-group, and ARARUKIRU machine, a JIARARUKIRU machine, Or the basis (R5xb expresses the phenyl group replaced by a low-grade alkyl-group and low-grade cycloalkyl machine, an ARARUKIRU machine, the phenyl group or the halogen atom, the low-grade alkyl group, or the lower alkoxy group.) expressed with formula R5 xb-CO- is expressed. The amino aza-AKURIJIN derivative expressed with], or its salt. As an example, 9-amino 8-fluoroes 1, 2, and 3, 4-tetrahydro 1, and 4-Etah Nor 1-aza-AKURIJIN etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,S63-166881,A, or it.

[0086] 27) Formula

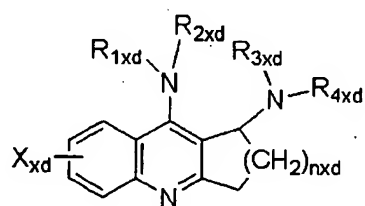
[Chemical formula 99]



Among [type, about a hydrogen atom or a low-grade alkyl group, R2xc shows independently a hydrogen atom or a low-grade alkyl group, or becomes together with R6xc, and R1xc shows an annular alkylene chain. R3xc and R4xc show a hydrogen atom independently respectively, or become together, and constitute the Kino Lynne ring or a tetrahydroquinoline ring with Ring Axc. Xxc shows an oxygen atom, a sulfur atom, or N-R5xc, and R5xc shows a hydrogen atom or a low-grade alkyl group. Yxc shows an oxygen atom or N-R6xc, and R6xc shows a hydrogen atom or a low-grade alkyl group, or it becomes together with R2xc and shows an annular alkylene independently. nxc shows 0 or 1 and mxc shows the integer of 0-4. The compound expressed with], or its salt. Specifically, 4'-amino [2 and 3-KINORINO b]-4-*****- 5, 6-dihydro1, 4-OKISAJIN and 4 '- amino 5, 6, 7, and 8'-tetrahydro [2 and 3-KINORINO b]-4-*****- 5, 6-dihydro1, and 4-OKISAJIN etc. is mentioned. The above-mentioned compound or its salt is manufactured by the method according to a method given in JP,H2-96580,A, or it.

[0087] 28) Formula

[Chemical formula 100]



Although n_{xd} is 1, 2, or 3 among [type, X_{xd} is hydrogen, low-grade ARUKIRU, and